

発癌性 5-ニトロフリルチアゾールの  
還元反応による成績体5-アミノ  
チアゾールの単離とその特性

市川 正孝\*, 藤岡 晴人, 日比野 俐,  
S.Swaminathan\*, E. Erturk\*\*, G.T. Bryan\*\*

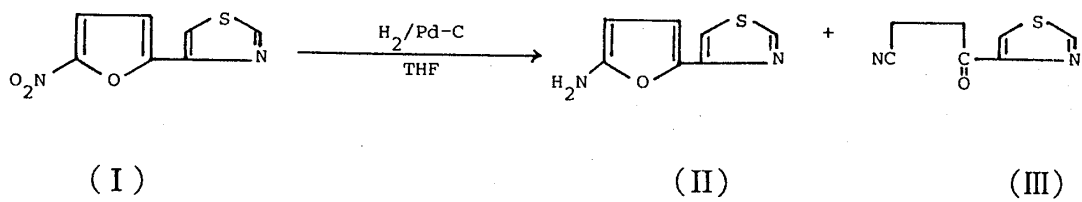
*Chemical & Pharmaceutical Bulletin*, 33(12), 5581-5584 (1985)

Isolation and Characterization of a New 5-Aminofurylthiazole from  
the Catalytic Reduction of 4-(5-Nitro-2-Furyl) Thiazole

Masataka ICHIKAWA\*, Haruto FUJIOKA, Satoshi HIBINO,  
Santhanam SWAMINATHAN\*\*, Erdogan ERTURK\*\* and George T. BRYAN\*\*

**ABSTRACT:** As a new extension of catalytic hydrogenation of 4-(5-nitro-2-furyl)thiazole, a convenient procedure for the synthesis of 4-(5-amino-2-furyl)thiazole has been developed using tetrahydrofuran and n-heptane to isolate enough 5-amino compound to determine the empirical formula. The 5-aminofurylthiazole was converted to 4-(5-acetylamino-2-furyl) thiazole and 4-(5-benzoylamino-2-furyl) thiazole. The stability of the 5-aminofuran ring in the pH 4.0 to 9.0 region was measured kinetically.

抄録 5-ニトロフリルチアゾール類 (I) はラットの膀胱に高い確率で発癌性を有する。代謝過程の検索では5-ニトロ基の還元性が確認されているが、5-アミノ体の還元成績体は単離されていない。そこで、5-アミノフリルチアゾール体 (II) を接触還元系から単離し、その安定性および5-アミノフリル体から3-シアノプロピオン (III) 構造へ変化する過程をU.V.スペクトルにより解析した。その結果、5-アミノフリルチアゾールは酸性側で不安定で、PH8~9で安定性が増加することが判明した。また、5-アミノフリルチアゾール体の減少に判い3-シアノプロピオン-チアゾールが増加し、同様にPH依存による生成率を得た。これにより5-アミノフリルチアゾール体は、1-(4-チアゾリル)-3-シアノ-1-プロパノンの先駆体の一つとして確認され得るであろう。



\* School of Medicine, Nagasaki University Hospital. 長崎大学医学部附属病院薬剤部

\*\* Wisconsin Clinical Cancer Center. ウィスコンシン大学臨床ガンセンター