

2-アルケニルアシルアニリン誘導体とオキシ塩化リンから導かれる2-アザヘキサトリエン系の熱環化反応によるキノリン環の簡易合成

日比野侗、杉野栄一

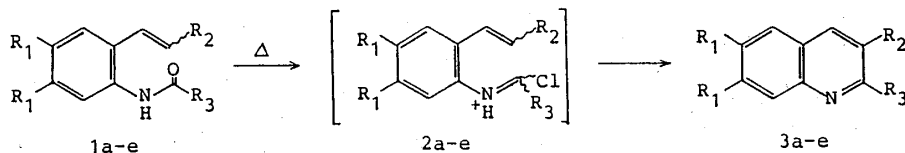
Heterocycles, 26 (7), 1883-1889 (1987)

A Facile and Alternative Synthesis of Quinoline Nucleus Using Thermal Cyclization of 2-Azahexatriene System Generated from 2-Alkenyl Acylaniline with POCl₃

Satoshi HIBINO and Eiichi SUGINO

ABSTRACT: The thermal cyclization of 2-alkenyl acylanilines with POCl₃ in toluene or xylene gave quinoline derivatives in good yield via 2-azahexatriene system in situ.

抄録 天然に広く分布しているキノリン類は、有用な薬理作用を持つものが多く、又置換基を有している場合が多い。アザヘキサトリエン系の熱閉環反応による縮合ピリジン類の合成研究の中で、2-アザヘキサトリエン系の熱環化反応を利用した新しいキノリン環合成法を検討した。2-ニトロベンズアルデヒド類から三行程で2-アザヘキサトリエン(2a~e)の前駆体の2-アルケニルアシルアニリン類(1a~e)を製した。それぞれを熱閉環反応に付したところ、電子供与性置換基を有する1b~eは76~90%の高収率でキノリン環を与えることが判明した。無置換の1aは34%と収率が悪く、電子供与性置換基が反応性を高めているものと考えられる。更に、閉環の温度条件は比較的低温、応用性に富むものと考えられる。



a: R₁=R₂=H, R₃=CH₃

b: R₁=OCH₃, R₂=H, R₃=CH₃

c: R₁=OCH₃, R₂=H, R₃=Ph

d: R₁=OCH₃, R₂=R₃=CH₃

e: R₁=OCH₃, R₂=CH₃, R₃=Ph

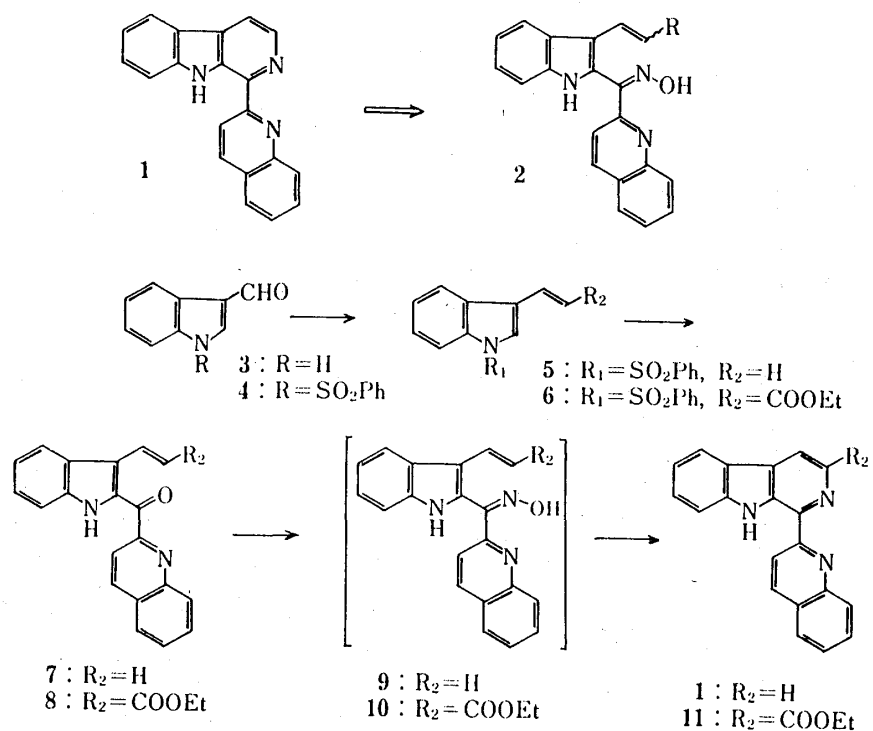


Chart 1

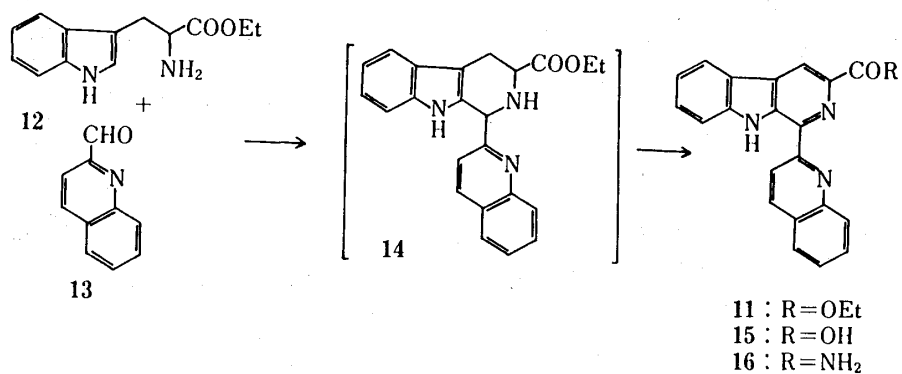


Chart 2

* Taisho Pharmaceutical Co., Ltd. 大正製藥総合研究所 薬理研