

共役アザヘキサトリエン系の熱電子環状反応による イソキノリン環の合成

日比野 俐, 杉野栄一, 安達裕起子, 乃美和彦, 佐藤浩一, 福本圭一郎*

Heterocycles, 28 (1), 275-282 (1989).

The Alternative Synthesis of Isoquinoline Nucleus using the Thermal Electrocyclic Reaction of 1-Azahexa-1,3,5-triene System

Satoshi HIBINO, Eiichi SUGINO, Yukiko ADACHI, Kazuhiko NOMI,
Kohichi SATO and Keiichiro FUKUMOTO*

ABSTRACT The thermal electrocyclic reaction of 2-alkenylbenzaldoximes or their derivatives having conjugated 1-azahexatriene system in *o*-dichlorobenzene gave isoquinolines in moderate to good yields except the reaction of unsubstituted 2-alkenylbenzaldoxime and its oxime ethers.

抄録 複素芳香環の1つの二重結合を含む共役アザヘキサトリエンの熱電子環状反応を利用する縮合複素芳香環類の合成の一環として、アプタミンの全合成の際にイソキノリン環部の形成に利用し成果を得ることができた。すなわち、従来のイソキノリン環の合成においてイソキノリン環の2位と3位の間での環形成に基づく報告例は極めて少なく、本法の一般性を検討した。N-ヒドロキシ(アルコキシ)イミノスチレン、すなわち1-アザヘキサトリエン系を*o*-プロモベンズアルデヒドより3~4行程で合成し、9種類について各種溶媒中加熱したところ、*o*-ジクロロベンゼン中の結果が最も良かった(50~88%)。置換基の影響については、電子供与性の置換基に収率の向上が見られ、無置換の場合には低下が見られた。一方、窒素原子における脱離基(ヒドロキシル基など)の差は観察されなかった。

* Pharmaceutical Institute, Tohoku University 東北大学薬学部