

2-アザヘキサトリエン系の電子環状反応による 変異原性アミノ- α -カルボリンA α CおよびMeA α Cの合成

日比野俐, 杉野栄一, 栞田剛志, 小倉直樹, 新谷陽子, 佐藤浩一

Chem. Pharm. Bull., 39(1)79-80 (1991)

Synthesis of mutagenic amino α -carbolines A α C and MeA α C by the thermal electrocyclic reaction of 2-azahexa-1,3,5-triene intermediates

Satoshi HIBINO, Eiichi SUGINO, Takeshi KUWADA

Naoki OGURA, Yokko SHINTANI and Kohichi SATOH

ABSTRACT The potent mutagens, 2-amino-9H-pyrido[2,3-b]indole (A α C) and 2-amino-3-methyl-9H-pyrido[2,3-b]indole (MeA α C) were synthesized by the thermal electrocyclic reaction of 2-azahexa-1,3,5-triene intermediates.

抄録 外因性のgenotoxic化合物として知られている α -カルボリン構造のA α C(3a)およびMeA α C(3b)の合成にアザヘキサトリエン系の電子環状反応を応用した。逆合成経路より導いた2-アザヘキサトリエン系(1aおよび1b)を経由すれば標的化合物の合成が達成できるものと想定した。2-アジド-1-ベンジルインドール-3-カルボキサアルデヒドを原料とし、アジド基にトリフェニルホスフィンを作用させイミノホスホランに導いたのち、Wittig反応によりアルデヒドをアルケンに変換した。そのまま反応系内にて、ベンジルイソシアネートとのaza-Wittig反応を行い中間体(1aおよび1b)が生成しているものとして加熱したところ、予期したように α -カルボリン体(2aおよび2b)を得ることができた。目的の3aおよび3bへは脱ベンジル化により到達した。

