

# 1-メチルアミノ-2,4-ビストリフルオロアセチルナフタレンとアルデヒド類およびアンモニア水との三成分縮合反応—新規含フッ素ジヒドロベンゾキナゾリン類の合成

(神戸大院工) 中川 爽馬・○岡田 悦治

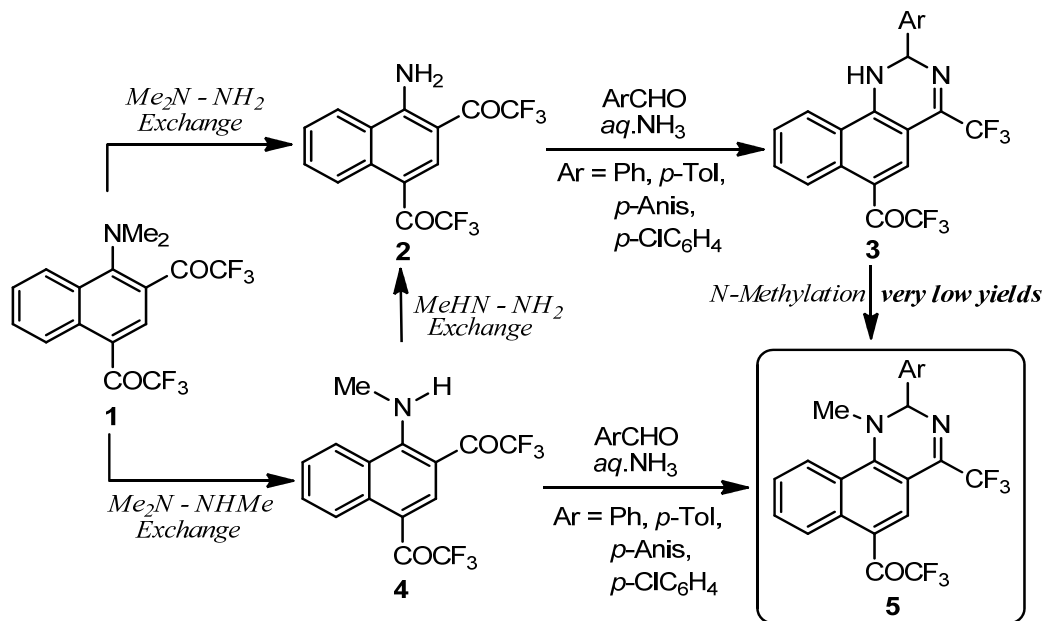
Three Components Condensation Reaction of 1-Methylamino-2,4-bis(trifluoroacetyl)-naphthalene with Aldehydes and Aqueous Ammonia: Synthesis of Novel Fluorine-Containing Dihydrobenzoquinazolines (*Graduate School of Engineering, Kobe University*)  
Souma Nakagawa, ○Etsuji Okada

Novel fluorine-containing dihydrobenzoquinazolines were synthesized in moderate yields via three components condensation reaction of 1-methylamino-2,4-bis(trifluoroacetyl)-naphthalene, aqueous ammonia and aromatic aldehydes such as benz-, *p*-anis-, *p*-tolu- and *p*-chlorobenzaldehydes.

**Keywords** : Dihydrobenzoquinazolines; Three Components Condensation Reaction; Trifluoromethyl Group; Aldehydes; Ammonia

1-ジメチルアミノ-2,4-ビストリフルオロアセチルナフタレン **1** とアンモニア水との N-N 交換反応により容易に合成できるアミノ体 **2** と芳香族アルデヒド類およびアンモニア水との三成分縮合反応により含フッ素ジヒドロベンゾキナゾリン類 **3** を高収率で合成できる<sup>1)</sup>。近年、**3** (Ar=Ph) の *N*-メチル化体 **5** (Ar=Ph) は興味ある生物活性を示すことが分かった。ところが、**3** の *N*-メチル化反応による **5** の合成収率はかなり低い。今回、**1** とメチルアミンとの N-N 交換反応により容易に合成できるメチルアミノ体 **4** と芳香族アルデヒド類およびアンモニア水との三成分縮合反応により新規含フッ素1-メチルジヒドロベンゾキナゾリン類 **5** を収率良く合成する事ができた。

**4** と *p*-クロロベンズアルデヒド (5 eq) およびアンモニア水 (3 eq) との三成分縮合反応 (at 40 °C for 24 h in MeCN) を行った場合、目的の1-メチルジヒドロベンゾキナゾリン **5** (Ar=*p*-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>) が62%の収率で得られた (**4** とアンモニア水との MeHN-NH<sub>2</sub> 交換生成物 **2** も13%副生した)。他の芳香族アルデヒド類との反応においても、中程度の収率で目的の1-メチルジヒドロベンゾキナゾリン類 **5** を得ることができた。



1) E. Okada, R. Masuda, M. Hojo, H. Tone, N. Gotoh, T. K. Huang, *Heterocycles* **1995**, 40, 905.