

キナゾリノン骨格を縮環した新規 1-アザアズレン誘導体の合成

(山口大学大学院¹・山口大学総合科学実験センター²) ○富士原 深唯¹・藤井 寛之²

Synthesis of novel 1-azaazulene derivatives fused quinazolinone skeleton (¹*Yamaguchi University Graduate School*, ²*Yamaguchi University Science Research Center*) ○Miyu Fujihara,¹ Hiroyuki Fujii²

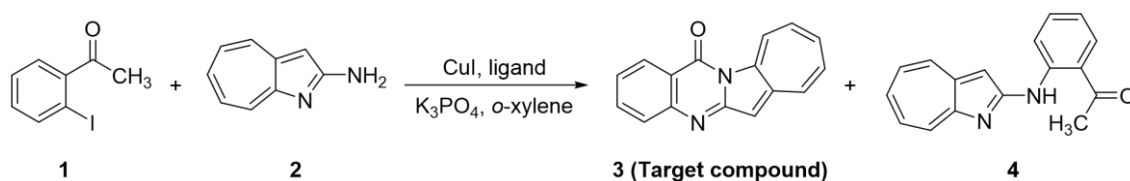
1-azaazulene derivatives, which are non-alternant aza-heterocyclic systems, are well known to have various functionalities, though there are fewer reports compared to alternant systems. However, it is interesting to the creation of new lead compounds using 1-azaazulene derivatives, an unexplored non-alternant system. In this reaction, we investigated the synthesis of novel 1-azaazulene derivatives fused quinazolinone skeleton, which is important for pharmacological activity. As a results of investigating various reaction conditions for reactant **1** and **2**, we succeeded in synthesis of the target compound **3**. We have also succeeded in the isolation of the synthetic intermediate **4** for the synthesis of the target compound **3** in this reaction.

In fact, as a result of the action of amino acids as additives, reaction intermediate **4** were obtained in yields of up to 66%. Therefore, we decided to focus on synthesizing the target compound **3** from reaction intermediate **4**.

Keywords : 1-azaazulene derivatives; non-alternant aza-heterocyclic systems; quinazolinone skeleton; pharmacological activity; amino acids

1-アザアズレン誘導体は非交互共役系含窒素複素環化合物であり、様々な機能性を有することが知られるが、交互共役系化合物と比較して報告例が少ない。しかし未開拓な非交互系の発展として、1-アザアズレン誘導体を利用した新たなリード化合物の創出には興味を持たれる。そこで本研究では、薬理活性に関して重要なキナゾリノン骨格を縮環した新規 1-アザアズレン誘導体の合成を検討することとした。反応物 **1** と **2** において、種々の反応条件を検討した結果、目的化合物 **3** の合成に成功した。また、本反応における目的化合物 **3** の合成中間体 **4** の単離にも成功している。

実際に、添加剤としてアミノ酸を作用させた結果、反応中間体 **4** が最大 66% の収率で得られた。そのため、反応中間体 **4** から目的化合物 **3** を合成することに注力することとした。



1) Matthias Brendel, Priyanka R. Sakhare, Gaurav Dahiya, Parthasarathi Subramanian, and Krishna P. Kaliappan, *J. Org. Chem.* **2020**, 85, 8102-8110.