

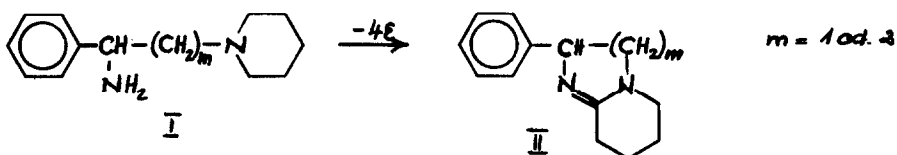
DARSTELLUNG VON 2,3-POLYMETHYLEN-3,4-DIHYDROCHINAZOLINEN

H.Möhrle und P.Gundlach

Pharmazeutisches Institut der Freien Universität Berlin

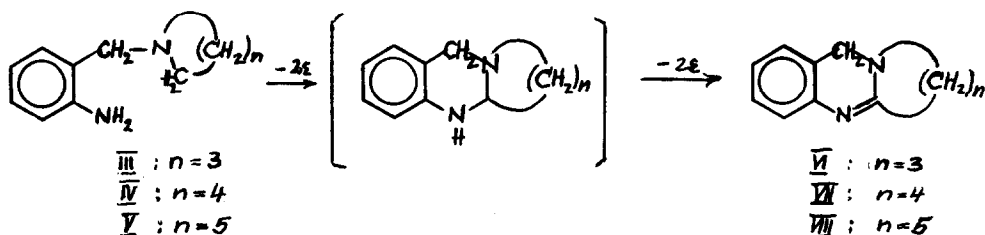
(Received in Germany 12 November 1969; received in UK for publication 9 February 1970)

Wie wir früher ¹⁾ zeigen konnten, liefern primär/tertiär-aliphatische Diamine I bei passender räumlicher Entfernung und sterischer Stellung der funktionellen Gruppen bei der Quecksilber(II)-ÄDTA-Dehydrierung cyclische Amidine II.

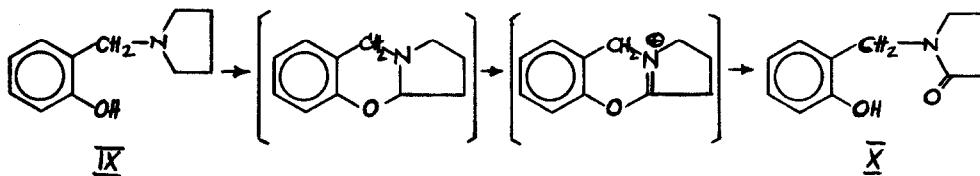


Es fragte sich nun, ob bei verminderter Nucleophilie der primären Aminogruppe die Addition an die, im Zwischenprodukt anzunehmende, Imoniumverbindung ebenfalls möglich ist.

Zu diesem Zweck wurden die entsprechenden Anilinderivate III - V dargestellt und der Quecksilber(II)-ÄDTA-Dehydrierung unterworfen.



Daraus resultierten in allen 3 Fällen die entsprechenden 3,4-Dihydrochinazolin-Derivate VI - VIII in guter Ausbeute. Beim Pyrrolidinderivat VI war dies besonders überraschend, da beim entsprechenden Phenol IX in analoger Reaktion das Phenollactam X nur in Spuren entstand ²⁾.



Es ist daher zu klären, ob Hydroxylgruppe und Aminfunktion bei der Cyclisierung oder bei der anschließenden Dehydrierung nicht äquivalent sind, oder ob die vergleichsweise größere Acidität des Phenols gegenüber einem alkoholischen Hydroxyl diesen Unterschied bewirkt. Entsprechende Untersuchungen sind im Gange.

VI: 2,3-Trimethylen-3,4-dihydrochinazolin, Schmp. 99-100° (Äther; Kofler)

Lit. ³⁾ 100-102°. Mol.-Gew. Ber.: 172,2 Gef.: 173,9 (CHCl₃); 172 (massenspektr.)
IR: 1630 cm⁻¹ (KBr) C=N-Valenzschwingung

Ausbeute: 53,2 % d.Th. bei 8 Oxyd.-Äquiv.

VII: 2,3-Tetramethylen-3,4-dihydrochinazolin, Schmp. 82° (Äther; Kofler)

Lit. ⁴⁾ 82-83° Mol.-Gew. Ber.: 186,3 Gef.: 189,4 (CHCl₃); 186 (massenspektr.)
IR: 1655 cm⁻¹ (KBr) C=N-Valenzschwingung

Ausbeute 67,3 % d.Th. bei 8 Oxyd.-Äquiv.

VIII: 2,3-Pentamethylen-3,4-dihydrochinazolin, Schmp.: 96° (Äther; Kofler)

Mol.-Gew. Ber.: 200,3 Gef.: 196,7 (CHCl₃); 200 (massenspektr.)

IR: 1610 cm⁻¹ (KBr) C=N-Valenzschwingung, Ausbeute: 79,2 % d.Th. bei 8 Oxyd.-Äquiv.

Literatur

- 1) H.Möhrle und S.Mayer, Tetrahedron Letters 1967, 5173
- 2) H.Möhrle und P.Gundlach, Tetrahedron Letters 1968, 5893
- 3) E.Späth, F.Kuffner und N.Platzer, Chem.Ber. 68, 497 (1935)
- 4) E.Späth und N.Platzer, Chem.Ber. 68, 2221 (1935)