

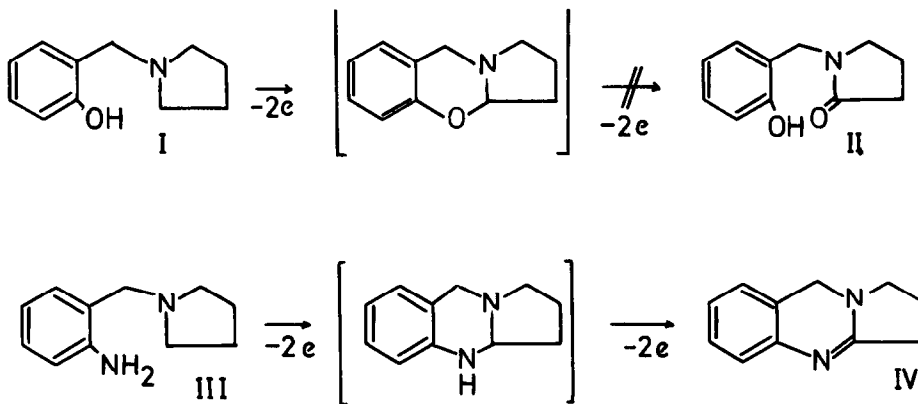
EINE NEUE SYNTHESE FÜR DL-VASICIN

H.Möhrle und P.Gundlach

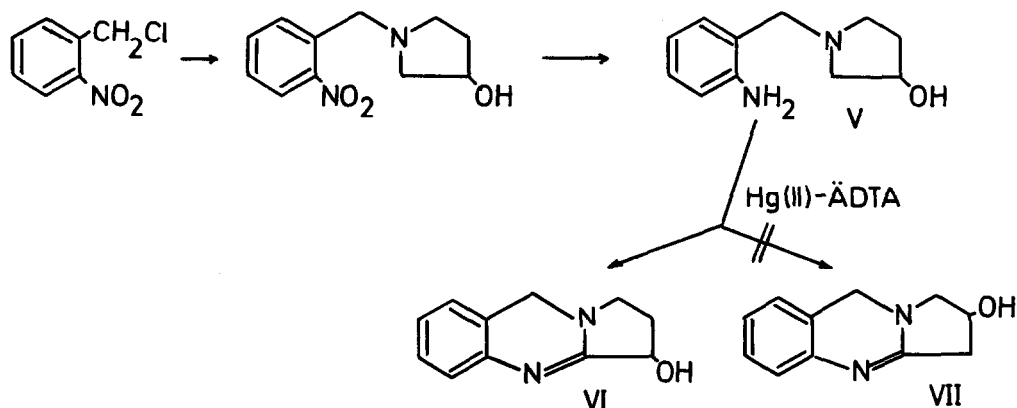
Pharmazeutisches Institut der Freien Universität Berlin

(Received in Germany 22 June 1970; received in UK for publication 9 July 1970)

Vor kurzem konnten wir zeigen¹⁾, daß bei der Quecksilber(II)-ÄDTA-Dehydrierung von tertiären Aminen auch aromatische Aminogruppen in geeigneter Stellung eine Reaktionsbeteiligung eingehen und unter doppelter Dehydrierung cyclische Amidine liefern. Überraschenderweise ergab bei den Anilinderivaten das 2-(Pyrrolidino-methyl)-anilin (III) in relativ guter Ausbeute das Dihydrochinazolinderivat IV, wogegen beim analogen Phenolabkömmling I das Lactam II nur in Spuren dünnenschichtchromatographisch nachgewiesen, aber nicht isoliert werden konnte²⁾.



Dies legte den Versuch einer Synthese von DL-Vasicin nahe, wobei folgende Stufen durchlaufen wurden:



Bei der intramolekularen dehydrierenden Cyclisierung des Hydroxy-Diamins V sind prinzipiell zwei Verknüpfungsarten im Hinblick auf die Stellung der Hydroxylgruppe am tricyclischen Endprodukt denkbar. Tatsächlich wird aber in 50proz. Ausbeute der Ringschluß zum DL-Vasicin (VI) erhalten und das isomere Produkt VII konnte bisher nicht isoliert werden.

Die Sicherung der Struktur von VI wurde durch Vergleich der physikalischen Konstanten und des spektralen Verhaltens mit authentischem DL-Vasicin eindeutig erbracht.

Der Deutschen Forschungsgemeinschaft und dem Fonds Chemie danken wir für die Unterstützung der Arbeit.

Literatur

- 1) H.Möhrle und P.Gundlach, Tetrahedron Letters 1970, 997
- 2) H.Möhrle und P.Gundlach, Tetrahedron Letters 1968, 5893