

Aufbau eines Yohimban-ähnlichen Heterocyclus

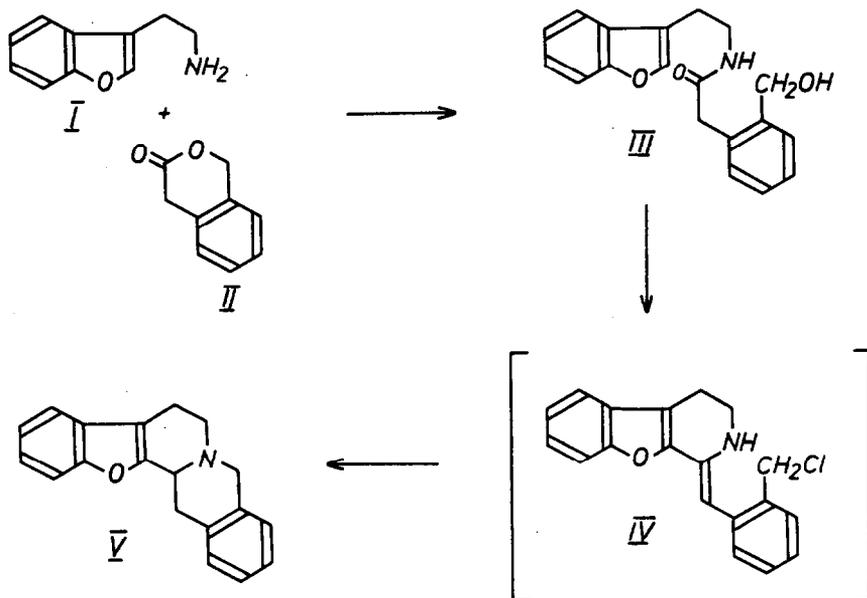
Zweistufensynthese von Benzofuro-benzo-chinolizidin

K. Weise und F. Zymalkowski

Pharm.Inst. der Universität Bonn, Deutschland

(Received in Germany 5 February 1971; received in UK for publication 22 March 1971)

3- $\beta$ -Benzofuryläthylamin (I) läßt sich ähnlich wie Tryptamin zum einfachen Aufbau heterocyclischer Ringsysteme einsetzen. Während aus Tryptamin in zwei Stufen der Pentacyclus des Yohimbans zugänglich ist, <sup>1)</sup> entsteht aus I das Sauerstoffanalogon V. Dazu wird I, nach einem modifizierten Verfahren der Fa. Hoffmann-La Roche <sup>2)</sup> hergestellt, zunächst mit Isochromanon (II) in das [o-Hydroxymethylphenyl]-acetyl-Derivat von I (III) verwandelt (Fp. 105°, 89 %). Unter Bischler-Napieralski-Bedingungen bildet sich das instabile, schwer zu isolierende 1-[o-Chlormethyl]-benzal-1,2,3,4-tetrahydro-benzofuro-[2,3-c]-pyridin (IV). Wenn man auf die Isolierung von IV verzichtet und das Rohprodukt unverzüglich in methanolischer Lösung mit Natriumborhydrid behandelt, erhält man unter intramolekularer N-Alkylierung und Reduktion die dem Yohimbanringsystem analoge Desaza-oxo-Verbindung V (Fp. von V·HCl 218° unter Zersetzung, 65 % bezogen auf I). Diese Reaktionen gelingen auch mit Methoxy-Derivaten von I oder II. Die Endprodukte interessieren im Hinblick auf ihre pharmakologische Wirkung.



1) W. Meise u. F. Zymalkowski; Angew. Chemie  
 Nr. 11; 1969, S. 425-26

2) Patent der Hoffmann-La Roche AG.