Summary

It was made clear that plasmochin is formed by the reaction of 6-methoxy-8-aminoquinoline, 5-diethylaminopentanone-2 and ethyl or methyl formate, with or without ethylene glycol, in an autoclave. Examinations were made to find the reaction conditions that would give the maximum yield. (Received February 26, 1951)

253. 富田眞雄, 上尾庄次郎, 御旅屋寛一：水酸基含有化合物を触媒とするロイカルト反應による芳香族アミンのアミノアルキル化に就いて (第 7 報¹⁾)
 プラスモヒンの合成 その 5

Masao Tomita, Shojiro Uyeo and Hirokazu Ota: The Aminoalkylation of Aromatic Amines by the Leuckart Reaction Catalyzed by Hydroxy Compounds. VII. The Preparation of Plasmochin. (5).

(Pharmaceutical Institute, Medical Faculty, University of Kyoto.)

前報で、我々は 6-methoxy-8-aminoquinoline (I) と 5-diethylaminopentanone-2 (II) を蟻酸エチル又はメチルと共に加圧釜中で反應せしめる時、プラスモヒンが得られる事を報告した。其の後、我々は若し沸点の高い多價アルコール類の蟻酸エステルを用いるならば、加圧釜中で熱しなくても常圧で反應が進行してプラスモヒンが生成するのではないかと考えて本研究を行つた。我々が使用した多價アルコールはエチレングリコールとグリセリンの 2 種である。それ等の蟻酸エステルを (I) 及び (II) と共に 175~185° に 20 時間反應せしめた所、次表の如き結果を得て我々の予想の誤りでない事が明かになつた。

実験 番号	(I)	(II)	添 加 剤	反應時間 hrs.	反應温度 °C	プラスモヒン	回収 (I)
1	117 g	78.5 g	グリコールヂ蟻酸エステル (59 g)	21	175~180	33.3 g (21.2%)	87.4 g
2	174 g	78.5 g	グリセリンヂ蟻酸エステル (74 g)	20	170~177	30.5 g (19.4%)	140 g

実 験 の 部

(I) 117 g, (II) 78.5 g 及びエチレングリコールヂ蟻酸エステル 59 g を三頸コルベンに入れ攪拌しつつ油浴中で 21 時間加熱する。反應温度は 175~180° である。その後 2 mm の減圧で反應物中からケトン及びエステルを回収し、残渣に苛性ソーダ 25 g, 水 225 g を加えて 3 時間加熱し、次いでエーテルで油狀物質を抽出し、エーテル抽出液を乾燥、留去し、残渣を分留するに bp_{0.09} 125~145° で (I) 87.4 g を回収する。次に bp_{0.1} 165~170° でプラスモヒン 33.3 g を得。

グリセリンヂ蟻酸エステルを使用した場合も操作法は同一である。

京都大学医学部薬学科

Summary

Plasmochin was prepared by the heating, at a normal pressure, of 6-methoxy-8-aminoquinoline, 5-diethylaminopentanone -2 and ethylene glycol or glycerol diformate.

(Received February 26, 1951)

1) 第 6 報：本誌 71, 846 (1951).