NMR (p.p.m.): 0.99 (3H), 1.49 (3H) ($-\overset{|}{\underset{|}{\text{C}}}-\text{CH}_3$); 1.39 (3H, doublet, $J=6.7$ c.p.s., $>\text{CH}-\text{CH}_3$); 2.03 (3H), 2.05 (3H), 2.07 (3H), 2.10 (3H) (OCOCH_3); 3.66 (1H, doublet, $J=6.0$ c.p.s., C_3-H); 4.74 (1H, multiplet, C_5-H); 5.56 (1H, quartet, $J_1=6.0$, $J_2=2.2$ c.p.s., C_2-H); 5.25 (1H), 5.81 (1H) (AB type quartet, $J_{AB}=11.0$ c.p.s., $\text{C}_{9,10}-\text{H}$).

Tetraacetyloxonortaxinol (XXX) の Zemplén の方法によるメタノリシス XXX 0.8 g. を anhyd. MeOH 24 ml. に溶かし, これに 0.1N MeOH 性 MeONa 8 ml. を加えて 0° で 24 hr. 放置する. 反応液を AcOH で中和し, MeOH を減圧で留去して得る残留物を CHCl_3 に溶かし水洗, 乾燥 (Na_2SO_4), CHCl_3 を留去すると結晶 (0.6 g.) を得る. これを acetone-*n*-hexane から再結晶すると enolether 体 (XXXI), m.p. $242\sim 245^\circ$, 針状晶を得る. $\text{C}_{24}\text{H}_{36}\text{O}_8$ Anal. Calcd.: C, 63.70; H, 8.02. Found: C, 63.81; H, 8.11. $[\alpha]_D +2.22^\circ$ ($c=0.90$, CHCl_3). UV $\lambda_{\text{max}}^{\text{EtOH}}$ m μ (ϵ): 219 (8900). IR $\nu_{\text{max}}^{\text{CHCl}_3}$ cm^{-1} : 3600, 3300 (OH), 1740 (OAc), 1700 ($>\text{CO}$), 1645 (enolether), 1068 (O-C). NMR (p.p.m.): 0.92 (3H), 1.16 (3H), 1.49 (3H) ($-\overset{|}{\underset{|}{\text{C}}}-\text{CH}_3$); 1.19 (3H, doublet, $J=6.7$ c.p.s., $>\text{CH}-\text{CH}_3$); 1.99 (3H), 2.04 (3H) (OCOCH_3); 3.40 (3H, OCH_3); 3.93 (1H, multiplet), 4.22 (1H, multiplet) (C_2-H および C_5-H); 5.20 (1H), 5.78 (1H) (AB type quartet, $J_{AB}=11.0$ c.p.s., $\text{C}_{9,10}-\text{H}$). monoacetate (XXXII). 上に得た XXXI 0.1 g. を常法どおり室温で Ac_2O と pyridine でアセチル化して得る結晶 (0.12 g.) を acetone-hexane から再結晶すると m.p. $176\sim 177^\circ$, 柱状晶を得る. $\text{C}_{26}\text{H}_{38}\text{O}_9$ Anal. Calcd.: C, 63.14; H, 8.02. Found: C, 62.94; H, 8.02. $[\alpha]_D -15.0^\circ$ ($c=0.80$, CHCl_3). IR $\lambda_{\text{max}}^{\text{CHCl}_3}$ cm^{-1} : 3300 (OH), 1740 (OAc), 1700 ($>\text{CO}$), 1648 (enolether), 1065 (O-C). NMR (p.p.m.): 0.93 (3H), 1.22 (3H), 1.50 (3H) ($-\overset{|}{\underset{|}{\text{C}}}-\text{CH}_3$); 1.25 (3H, doublet, $J=6.5$ c.p.s., $>\text{CH}-\text{CH}_3$); 2.02 (3H) (OCOCH_3); 3.43 (3H, OCH_3); 4.27 (1H, multiplet, C_2-H または C_5-H); 5.17 (1H, multiplet, C_2-H または C_5-H); 5.23 (1H), 5.81 (1H) (AB type quartet, $J_{AB}=11.0$ c.p.s., $\text{C}_{9,10}-\text{H}$).

京都大学薬学部, 東洋レーヨン株式会社基礎研究所, 岐阜薬科大学

〔薬 学 雑 誌〕
YAKUGAKU ZASSHI
85 (5) 418 ~ 423 (1965)

UDC 547.722.5.07

65. 杉原 明, 伊藤真純: ニトロフラン誘導体の合成研究 (第1報)

Pyrimidinyl Hydrazone 類の合成^{*1}

Akira Sugihara and Masumi Ito: Synthesis of Nitrofuran Derivatives. I.
Synthesis of Pyrimidinyl Hydrazones.

(Research Laboratories, Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.*2)

4,6-Disubstituted 2-benzylidenehydrazinopyrimidines gave the corresponding 4,6-disubstituted 2-(5-nitro-2-furfurylidenehydrazino)pyrimidines upon treatment with 5-nitro-2-furaldehyde in acidic condition. Several other 5-nitro-2-furfurylidenehydrazinopyrimidines were prepared by condensation of the corresponding substituted pyrimidinylhydrazines with 5-nitro-2-furaldehyde. Most of these nitrofuran compounds were found to be active against *Trichomonas vaginalis in vitro*.

(Received September 21, 1964)

Dodd および Stillman¹⁾ が 5-nitro-2-furaldehyde semicarbazone を発見し, ニトロフラン誘導体が広範囲な抗菌スペクトルを有しかつ他薬剤との交叉耐性が少ないことが知られて以来, 数多くのニトロフラン誘導体が合成され化学療法剤としての検討が加えられてきたが, 現在までのところニトロフラン誘導体は一般に毒性が強く, そして吸収性と生体内安定性が悪いなどの欠点のためにスルホンアミド剤に比肩し得る化合物はまだ発見されていない。

*1 日本薬学会近畿支部昭和37年度総会発表。

*2 Kashima-cho, Higashiyodogawa-ku, Osaka.

1) M. C. Dodd, W. B. Stillman: J. Pharmacol. Exptl. Therap., 82, 11 (1944).

しかしながら, 広範囲な抗菌スペクトルと他薬剤との交叉耐性が少ないニトロフラン誘導体の特性はスルホンアミド剤以外に優秀な合成化学療法剤の少ない今日においては捨てがたく, 著者等はこの特性を備え, かつ毒性が弱く内服により高血中濃度の得られるニトロフラン誘導体を得る目的でその合成研究を開始した。

5-nitro-2-furaldehyde pyrimidinyl hydrazone 類の一般的合成法として 5-nitro-2-furaldehyde と pyrimidinylhydrazine 類の縮合反応が知られている.^{2,3)} 著者等は一般的合成法によって合成しがたい 5-nitro-2-furaldehyde (4-chloro-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (V) の合成法を検討して 1, 2 の知見を得た。

Chart 1.

(4-hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazine (I)⁴⁾ のクロル化による (4-chloro-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazine (II) の合成が困難であったので, 著者等はまず, Chart 1 に示すように benzaldehyde (4-hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (III)⁵⁾ をオキシン塩化リンとともに 30 分間加熱還流して m.p. 185~186° の無色針状結晶, benzaldehyde (4-chloro-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (IV) を収率 78.8% で得た. IV を 3% 塩酸とともに煮沸して加水分解を行なったが II を単離することはできなかった. つぎに, IV を 5-nitro-2-furaldehyde⁶⁾ とともに 4% 塩酸中で 1.5 時間 50~60° に加温することにより m.p. 260°(decomp.) の黄色微針状結晶 (V) が収率 87.8% で得られた. また, V は 5-nitro-2-furaldehyde (4-hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (VI)³⁾ をオキシン塩化リンとともに 30 分間加熱還流した場合にも収率 89.0% で得られた。

2) 志甫, 高林: 日化, **76**, 877 (1955).

3) 平尾, 藤本, 加藤, 岡崎: 工化, **66**, 1682 (1963).

4) 松川, 伴, 白川, 米田: 本誌, **73**, 159 (1953).

5) E. Birr, W. Walther: Chem. Ber., **86**, 1401 (1953).

6) H. Gilman, G.F. Wright: J. Am. Chem. Soc., **52**, 2551 (1930).

IV に sodium methoxide または sodium methanethiolate⁷⁾ を 50~57° で 1~2 時間反応させると淡黄色針状結晶の benzaldehyde (4-methyl-6-methoxy-2-pyrimidinyl)hydrazone (VII), m.p. 164~165° または無色微針状結晶の benzaldehyde (4-methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazone (IX), m.p. 144~146° がそれぞれ収率 83.9, 71.8% で得られる. ここに得た VII または IX を 5-nitro-2-furaldehyde とともに希塩酸の存在下に加熱して, それぞれ対応する橙黄色針状結晶の 5-nitro-2-furaldehyde(4-methyl-6-methoxy-2-pyrimidinyl)hydrazone (VIII), m.p. 247°(decomp.) または橙黄色微針状結晶の 5-nitro-2-furaldehyde (4-methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazone (X), m.p. 226~227° を好収量で得た. また, 2-chloro-4-methyl-6-methylthiopyrimidine (XI)⁸⁾ に 50% ヒドラジンを炭酸カリの存在下で 50° に 1.5 時間加温して得られる m.p. 123~124° の無色鱗片結晶, (4-methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazine (XII) に 5-nitro-2-furaldehyde を反応させても X が得られた.

Vystrčil 等⁹⁾ は 2-ethylthio-4-methoxy-6-methylpyrimidine にヒドラジンを反応せしめて (4-methoxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazine を得たと報告しているが, Chart 2 に示すように著者等は 2-methylthio-4-methoxy-6-methylpyrimidine (XIV)¹⁰⁾ をヒドラジンとともにエタノール中で 17 時間加熱還流して m.p. 142° の無色針状結晶, (2-methylthio-4-methyl-6-pyrimidinyl)hydrazine (XV) を少量得た. この XV はまた 2-methyl-

Chart 2.

Chart 3.

7) R. Phillips, H. T. Clarke: J. Am. Chem. Soc., **45**, 175 (1923).

8) A. D. Ainley, et al.: Brit. Pat., 658,202 (1951) (C. A., **46**, 9619 (1952)).

9) A. Vystrčil, J. Vidlička: Chem. Listy, **45**, 407 (1951) (C. A., **46**, 7567 (1952)).

10) 松川, 白川: 本誌, **71**, 933 (1951).

TABLE I.

Compd. No.	R	n	Yield (%)	m.p. (°C)	Formula	Analysis (%)					
						Calcd.			Found		
						C	H	N	C	H	N
VIII		0	92.7	247 (decomp.)	$\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{O}_4\text{N}_5$	47.65	4.00	25.26	47.93	4.03	25.11
X		0	90.2	226~227	$\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{O}_3\text{N}_5\text{S}$	45.05	3.78	23.88	45.17	4.11	23.88
XXII		0	86.8	251	$\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{O}_3\text{N}_5\text{S}$	45.05	3.78	23.88	44.91	4.03	24.22
XXIII		0	69.6	223 (decomp.)	$\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{O}_4\text{N}_5$	47.65	4.00	25.26	47.45	4.18	24.87
XXIV		0	76.8	276 (decomp.)	$\text{C}_{15}\text{H}_{11}\text{O}_4\text{N}_5$	55.38	3.41	21.53	55.00	3.65	22.09
XXV		1	71.1	264 (decomp.)	$\text{C}_{12}\text{H}_{11}\text{O}_4\text{N}_5$	49.83	3.83	24.21	50.00	3.94	24.47

thio-4-chloro-6-methylpyrimidine (XIII)¹¹⁾ にヒドラジンをエタノール中で3時間反応せしめることにより収率 53.9% で得られた。その際に、副生成物として m.p. 212~213° の白色粉末結晶, 2,4-dihydrazino-6-methylpyrimidine (XVI) が収率 5.3% で得られた。また, 2-methylthio-4-ethyl-6-pyrimidinol (XVII)⁸⁾ に過剰のヒドラジンを反応せしめて m.p. 202° の無色微針状結晶, (4-ethyl-6-hydroxy-2-pyrimidinyl)hydrazine (XVIII) を収率 73.6% で得た。

つぎに Chart 3 に示すように, XV, XVIII ならびに (4-hydroxy-6-phenyl-2-pyrimidinyl)hydrazine¹²⁾ に 5-nitro-2-furaldehyde を縮合せしめてそれぞれ 5-nitro-2-furaldehyde (2-methylthio-4-methyl-6-pyrimidinyl)hydrazine (XXII), 黄色結晶, m.p. 251°; 5-nitro-2-furaldehyde (4-ethyl-6-hydroxy-2-pyrimidinyl)hydrazine (XXIII), 橙黄色結晶, m.p. 223°(decomp.) および 5-nitro-2-furaldehyde (4-hydroxy-6-phenyl-2-pyrimidinyl)hydrazine (XXIV), 黄色結晶, m.p. 276°(decomp.) を得た (Table I)。

また, 5-nitro-2-furanacrolein¹³⁾ と I から m.p. 264°(decomp.) の橙赤色結晶, 5-nitro-2-furanacrolein (4-

11) J. F. W. McOmie, *et al.*: J. Chem. Soc., 1957, 1830.

12) D. Libermann, A. Rouaix: Compt. rend., 240, 984~986 (1955) (C. A., 50, 5679 (1956)).

13) H. Saikachi, H. Ogawa: J. Am. Chem. Soc., 80, 3642 (1958).

hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (XXV) を得た.

著者等が合成した V, VIII, X, XXII, XXIII, XXIV および XXV について中性ブイオン培地中で *Escherichia coli* NIH J 株および *Staphylococcus aureus* FDA 209 株に対する抗菌力を検定し, V ブイオン培地中で *Trichomonas vaginalis* 4 FM 株に対する抗原虫力を検定した. その結果を Table II に示す.

TABLE II. Antimicrobial Activity of 5-Nitro-2-furyl Aldehyde Pyrimidinyl Hydrazone Derivatives ($\mu\text{g./ml.}$)

Compd. No.	<i>Escherichia coli</i> ^{a)}	<i>Staphylococcus aureus</i> ^{a)}	<i>Trichomonas vaginalis</i> ^{b)}
V	>80	>80	20
VIII	>80	>80	5
X	>80	>80	2
XXII	>80	>80	5
XXIII	20	>80	10
XXIV	>80	>80	80
XXV	>80	>80	20

a) Incubated at 37° for 20 hr. in neutral bouillon medium

b) Incubated at 37° for 48 hr. in V bouillon medium

Table II から明らかなごとく, これらの化合物は一般に細菌に対するよりも *Trichomonas vaginalis* に対して強い作用を示す. VIII は毒性も弱く, ハツカネズミに胃内投与した場合の LD_{50} は $>2400 \text{ mg./kg.}^{14)}$ である.

以上の結果より, 5-nitro-2-furaldehyde pyrimidinyl hydrazone 類の中には抗トリコモナス性が強く, かつ毒性の弱い化合物のあることがわかった. したがってニトロフラン誘導体は単に抗細菌性物質として検討されるだけでなく内服用抗トリコモナス剤としても検討されるべき価値を有していると考えられる.

実 験 の 部

Benzaldehyde (4-chloro-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (IV) benzaldehyde (4-hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (III)⁵⁾ 5.3 g., POCl_3 37 ml. を $110\sim 120^\circ$ に 0.5 hr. 加熱還流. 過剰の POCl_3 を減圧にて留去し, 残留物を氷水 100 ml. 中に注入する. NaHCO_3 で中和後, 結晶を濾取し EtOH から再結晶させると m.p. $185\sim 186^\circ$ の無色針状結晶 4.5 g. (78.8%) を得. $\text{C}_{12}\text{H}_{11}\text{N}_4\text{Cl}$ Anal. Calcd.: C, 58.42; H, 4.50; N, 22.71; Cl, 14.37. Found: C, 58.76; H, 4.60; N, 23.09; Cl, 14.62.

5-Nitro-2-furaldehyde (4-chloro-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (V) a 法 N 9.0 g. を 4% HCl 205 ml. に懸濁し, 5-nitro-2-furaldehyde⁶⁾ 11.0 g. を加え $50\sim 60^\circ$ で 1.5 hr. 攪拌. 反応終了後, 生成したベンズアルデヒドをベンゼンにて抽出除去し, 水層部を冷却すると黄色結晶が析出する. NaHCO_3 で中和した後, 結晶を濾取しアセトンから再結晶すると m.p. $260^\circ(\text{decomp.})$ の黄色微針状結晶 9.0 g. (87.8%) を得. $\text{C}_{10}\text{H}_5\text{O}_3\text{N}_5\text{Cl}$ Anal. Calcd.: C, 42.64; H, 2.86; N, 24.87; Cl, 12.59. Found: C, 42.73; H, 2.89; N, 25.03; Cl, 12.59.

b 法 5-nitro-2-furaldehyde (4-hydroxy-6-methyl-2-pyrimidinyl)hydrazone (VI)⁹⁾ 4.3 g., POCl_3 30 ml. を $110\sim 120^\circ$ に 0.5 hr. 加熱. 過剰の POCl_3 を減圧にて留去し残留物を氷水に加え NaHCO_3 で中和後結晶を濾取. ジメチルホルムアミドから再結晶して V 4.1 g. (89.0%) を得.

Benzaldehyde (4-methyl-6-methoxy-2-pyrimidinyl)hydrazone (VII) N 4.0 g. を abs. MeOH 90 ml. に溶解し, これに Na 0.39 g. を abs. MeOH 10 ml. に溶解した液を攪拌しつつ, $50\sim 57^\circ$ で 1 hr. で滴下し, さらに 1 hr. 攪拌しつつ加温を続ける. 反応終了後, 溶媒を留去し残留する結晶に H_2O を加えて濾取. リグロインから再結晶し, m.p. $164\sim 165^\circ$ の淡黄色針状結晶, 3.3 g. (83.9%) を得. $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{ON}_4$ Anal. Calcd.: C, 64.44; H, 5.82; N, 23.13. Found: C, 64.38; H, 6.00; N, 23.41.

5-Nitro-2-furaldehyde (4-methyl-6-methoxy-2-pyrimidinyl)hydrazone (VIII) a 法 VII 3.0 g. を 4% HCl 68 ml. に懸濁し 5-nitro-2-furaldehyde 3.6 g. を加え $50\sim 60^\circ$ で 1.5 hr. 攪拌. 反応終了後, V と同様に処理し粗結晶を MeOH から再結晶すると m.p. $247^\circ(\text{decomp.})$ の橙黄色針状結晶 2.9 g. (84.2%) を得. 本品の IR スペクトルは b 法により得た VIII の IR スペクトルと完全に一致した.

b 法 Chart 3 に示すように 5-nitro-2-furaldehyde と (4-methyl-6-methoxy-2-pyrimidinyl)hydrazine¹⁵⁾

14) 唐崎: Chemotherapy, 12, 99 (1964).

15) 白川, 伴, 米田: 本誌, 73, 598 (1953).

から合成 (Table I).

Benzaldehyde (4-methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazone (IX) N 4.0 g. を無水ジオキサン 80 ml. に溶解し, これに $\text{CH}_3\text{SnA}^{(7)}$ 1.4 g. を加え 50° で 1 hr. 攪拌. 反応終了後, 溶媒を留去し残留物に水を加えて結晶を回収. EtOH から再結晶し m.p. $144\sim 146^\circ$ の無色微針状結晶 3.0 g. (71.8%) を得. $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_4\text{S}$ Anal. Calcd.: C, 60.45; H, 5.46; N, 21.70; S, 12.39. Found: C, 60.52; H, 5.59; N, 21.94; S, 12.04.

(4-Methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazine (XII) 2-chloro-4-methyl-6-methylthiopyrimidine(XI)⁽⁸⁾ 1.2 g. をエーテル 5 ml. に溶解し, この溶液を 50% $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ 4.0 g. および K_2CO_3 2.0 g. の溶液に加えて, 50° にて 1.5 hr. 攪拌. 反応終了後, 析出結晶を回収し 95% EtOH から再結晶して m.p. $123\sim 124^\circ$ の無色鱗片結晶 0.6 g. (51.4%) を得. $\text{C}_6\text{H}_{10}\text{N}_4\text{S}$ Anal. Calcd.: C, 42.35; H, 5.92; N, 32.93; S, 18.80. Found: C, 42.30; H, 6.00; N, 33.25; S, 18.85.

5-Nitro-2-furaldehyde (4-methyl-6-methylthio-2-pyrimidinyl)hydrazone (X) a 法 K 2.6 g. を 4% HCl 60 ml. に懸濁し, 5-nitro-2-furaldehyde 2.8 g. を加え $50\sim 60^\circ$ で 1.5 hr. 攪拌. 反応終了後 V と同様に処理し粗結晶をアセトンから再結晶し m.p. $226\sim 227^\circ$ の橙黄色微針状結晶 2.7 g. (91.3%) を得. 本品は混融試験ならびに IR スペクトルにより b 法で得た X と同定した.

b 法 Chart 3 に示すように 5-nitro-2-furaldehyde と XII から合成 (Table I).

2-Methylthio-4-methoxy-6-methylpyrimidine (XIV)⁽¹⁰⁾ と $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ の反応 XIV 3.0 g., $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ 2 ml., 99% EtOH 20 ml. を 17 hr. 加熱還流. 反応終了後, 減圧にて濃縮し析出結晶を回収. 含水 EtOH から再結晶して m.p. 142° の無色微針状結晶, (2-methylthio-4-methyl-6-pyrimidinyl)hydrazine (XV) 0.7 g. (23.3%) を得. $\text{C}_6\text{H}_{10}\text{N}_4\text{S}$ Anal. Calcd.: C, 42.35; H, 5.92; N, 32.93; S, 18.80. Found: C, 42.39; H, 6.12; N, 33.34; S, 19.21.

2-Methylthio-4-chloro-6-methylpyrimidine (XIII)⁽¹¹⁾ と $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ の反応 XIII 4.0 g., $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ 3.9 g., abs. EtOH 25 ml. を 3 hr. 加熱還流. 反応終了後, 減圧にて濃縮し残留結晶を CHCl_3 で温時抽出. CHCl_3 抽出物を H_2O から再結晶して m.p. $140\sim 141^\circ$ の XV 2.1 g. (53.9%) を得. CHCl_3 抽出残渣を H_2O から再結晶して m.p. $212\sim 213^\circ$ の白色粉末結晶, 2,4-dihydrazino-6-methylpyrimidine (XVI) 0.2 g. (5.3%) を得. $\text{C}_6\text{H}_{10}\text{N}_6$ Anal. Calcd.: C, 38.95; H, 6.54; N, 54.51. Found: C, 38.63; H, 6.38; N, 55.03.

(4-Ethyl-6-hydroxy-2-pyrimidinyl)hydrazine (XVIII) 2-methylthio-4-ethyl-6-pyrimidinol (XVII)⁽⁸⁾ 0.45 g., $\text{H}_2\text{N}\cdot\text{NH}_2\cdot\text{H}_2\text{O}$ 0.3 g., abs. EtOH 1 ml. を 5 hr. 加熱還流. 冷後, 析出結晶を回収し EtOH にて洗浄. H_2O から再結晶し m.p. 202° の無色微針状結晶 0.3 g. (73.6%) を得. $\text{C}_6\text{H}_{10}\text{ON}_4$ Anal. Calcd.: C, 46.74; H, 6.54; N, 36.34. Found: C, 46.90; H, 6.75; N, 36.33.

5-Nitro-2-furylaldehyde pyrimidinylhydrazone 類 (XXI) の一般的合成法 計算量よりやや過剰の 5-nitro-2-furylaldehyde 類 (XIX) の EtOH 溶液を計算量の pyrimidinyl hydrazine 類 (XX) の HCl 水溶液に加え, 室温において暫時攪拌. 後, NaHCO_3 にて中和し析出結晶を回収し水洗. ジオキサン, アセトンまたはジメチルホルムアミドから再結晶, 収率 69.6~92.7% (Table I).

本研究に際して発表の機会を与えられました藤沢薬品工業株式会社社長 藤沢友吉氏, 終始御指導, 御鞭撻を賜わった中央研究所長 小原正郎博士ならびに山元清嗣博士に深謝するとともに実験に協力された水俣博昭氏, IR スペクトルの測定を担当された近藤尚志氏, 元素分析を担当された太田茂輝, 小室友重両氏に感謝します. また, 生物学的性質の検討を担当された当研究所の微生物部門の各氏に謝意を表します.

藤沢薬品工業株式会社中央研究所