

〔RADIOISOTOPES, 28, 572 (1979)〕

Synthesis of 3'-Hydroxymethyl-4-(dimethylamino)azobenzene
〔carbinol- ^{14}C 〕

YUKIO MORI, TOSHIRO NIWA, KAZUMI TOYOSHI

3'-Hydroxymethyl-4-(dimethylamino)azobenzene 〔carbinol- ^{14}C 〕 の合成

森 幸雄, 丹羽俊朗, 豊吉一美

3'-Methyl-4-(dimethylamino)azobenzene (3'-Me-DAB) は DAB よりも強い発肝癌性を示すのに対して, 2'-Me-DAB および 4'-Me-DAB は非常に弱い発癌活性しか持たないことが知られている。近年, 著者らは 3'-Me-DAB の代謝には 3'位メチル基の酸化反応が認められることを明らかにした。そこで, 3'-Me-DAB の 3'位部位での代謝をさらに追求することを目的に, 3'-CH₂OH-DAB の carbinol炭素を ^{14}C で標識する方法を検討した。

Benzoic acid 〔carboxyl- ^{14}C 〕 (II) を出発物質として, ニトロ化, ニトロ基の還元, カルボキシル基の還元およびジアゾ化, カップリングすることにより 3'-CH₂OH-DAB 〔carbinol- ^{14}C 〕 (I) を合成した (Fig. 1)。この4ステップの合成 (II → I) における放射化学的収率は約15%であり, I の比放射能は 13.5MBq/mmol であった。また放射化学的純度はラジオ TLC 法で検討したところ, 97%以上であることを確認した。したがって, 3'-CH₂OH-DAB の *in vivo* または *in vitro* の代謝の検討に I は十分に使用することが出来ると思われる。

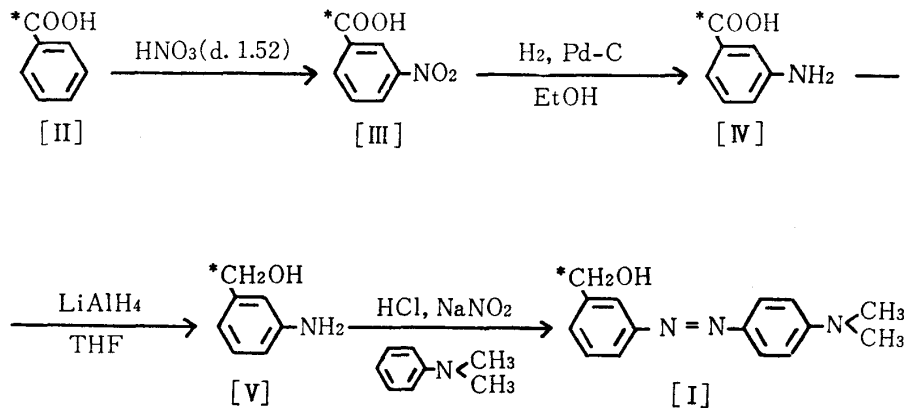


Fig. 1 Synthesis of 3'-hydroxymethyl-4-(dimethylamino)azobenzene 〔carbinol- ^{14}C 〕.