

[J. Org. Chem., 45, 3827 (1980)]

Synthesis of pyrrolo [3,2-*d*] pyrimidines from Furazano [3,4-*d*]-pyrimidines *via* Enolate and Ene Adducts

L. ERIC CRANE*, G. PETER BEARDSLEY, YOSHIEUMI MAKI

Enolate および Ene 付加体を経る Furazano [3,4-*d*] pyrimidine から pyrrolo [3,2-*d*] pyrimidine の合成

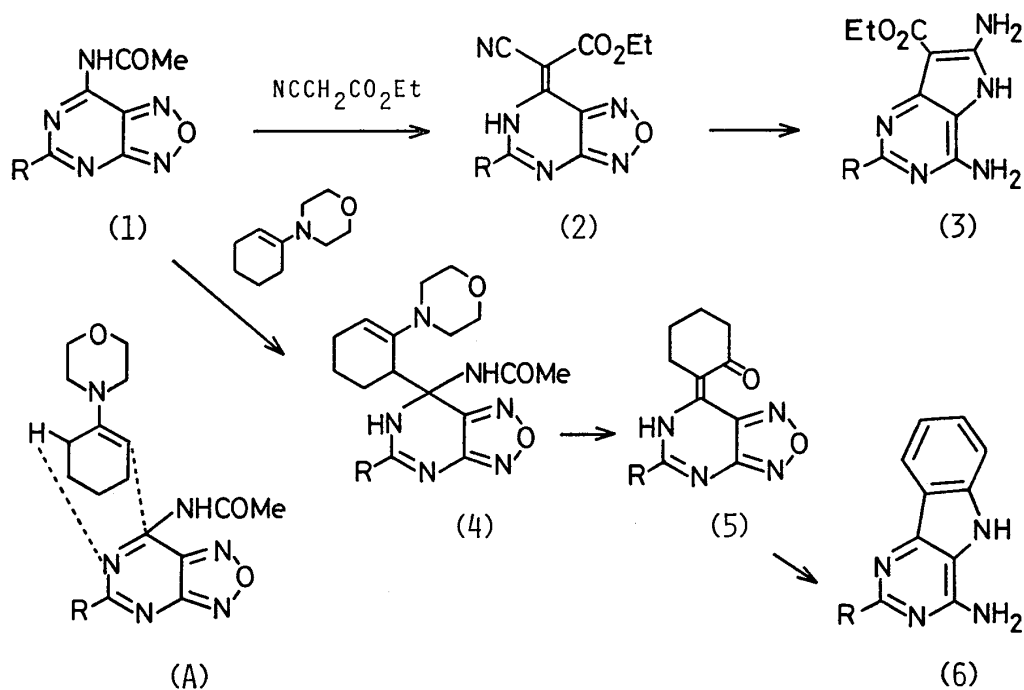
L. Eric Crane*, G. Peter Beardsley, 牧 敬文

7-aminofurazano [3,4-*d*] pyrimidine は環転換により種々の縮合ピリミジン類を生成する。活性化された 7-acetylamino 体(1)に塩基存在下活性メチレン化合物,あるいはエナミンを反応すれば(1)の 7 位に C-C 結合が形成されることを見出した。さらに還元的再開環によって pyrrolo [3,2-*d*] pyrimidine 類に mild な条件で誘導できる。

例えば(1)は常温で ethyl cyanoacetate (Et₃N 存在下)と反応して(2)を生成し, Pd-C で還元すれば pyrrolopyrimidine (3)を高収量で生成する。

また(1)は morpholinocyclohexene と ether 中で反応して(A)のような ene 反応で生成したと思われる付加体(4)を与える。酸処理後還元的再開環すれば(5)を経て pyrrolopyrimidine (6)が得られた。

これらの知見は furazanopyrimidine の特異な反応性および合成中間体としての有用性を示すものである。



* プリンストン大学