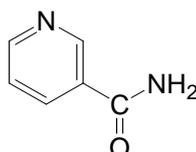


## 『有機化学』章末問題解答 18 章

1. 日本薬局方医薬品ニコチン酸アミドの合成法に関する記述 a～ e のうち、正しいものを選び。



ニコチン酸アミド

- a. ニコチン酸を塩化チオニルと反応させ、ニコチン酸クロリドに変換し、ついで封管中アンモニアと加熱する。
- b. ニコチン酸をエタノールと酸でエステル化し、ついでエタノール性アンモニアと加熱する。
- c. 2-シアノピリジンを濃アンモニア水と封管中加熱する。
- d. 3-アミノピリジンを酢酸と加熱する。
- e. 3-アミノピリジンのアミノ基を亜硝酸と反応させてジアゾ化し、ついで水と加熱する。

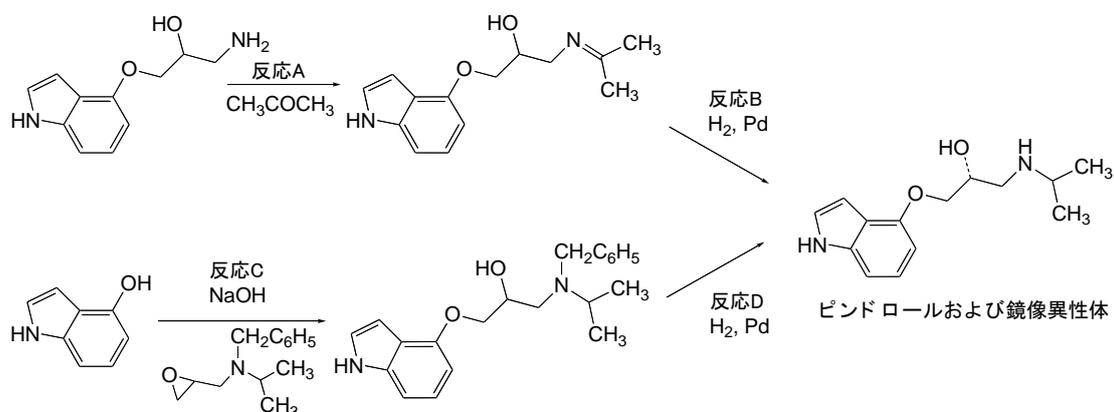
## 【解答】

- a. 正 酸塩化物はアミンと反応し、アミドが生成する。
- b. 正 エステルはアミンと反応し、アミドが生成する。
- c. 誤 アミド化反応であるが、2位にシアノ基があるのでニコチン酸アミドは得られない。
- d. 誤 3位のアミノ基をアミド化してもニコチン酸アミドにならない。
- e. 誤 ジアゾ化によってアレーンジアゾニウム塩が得られるが、これは水と反応してフェノールになる。



d. 誤 アミドなので塩基性を示さない。

3. 次の反応式は日本薬局方医薬品ピンドロール（ $\beta$ 遮断薬）およびその鏡像異性体の二つの合成法を示したものである。この合成法に関する記述のうちで正しいものを選び。ただし、図中の不斉炭素をもつ化合物はすべてラセミ体である。



- 反応 A は、カルボニル炭素に対するアミンの求核置換反応である。
- 反応 C は、インドール環上のヒドロキシアニオンのエポキシドに対する求核的な反応である。
- エポキシドは、結合角によるひずみのため、通常のエーテルとは異なる反応性を示す。
- 反応 D では、窒素原子とベンジル基の間の結合が還元的に開裂する。

【解答】

- 誤 カルボニルに対するアミンの求核付加反応によってイミンが形成される。
- 正 エポキシドに対する求核置換反応である。
- 正 一般にエーテルは安定であるが、エポキシドは三員環のゆがみによる高い反応性を示す。
- 正 接触還元により結合が切断される。