

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Десенко С. М., Орлов В. Д., Гетманский Н. В., Шишкин О. В., Линдеман С. В., Стручков Ю. Т. // ХГС. — 1993. — № 4. — С. 481.
2. Десенко С. М., Орлов В. Д., Бескоровайный В. И., Успенский Б. В. // Доклады АН УССР. Сер. Б. — 1989. — № 3. — С. 38.

С. М. Десенко, В. Д. Орлов, Н. В. Гетманский,
Б. В. Папонов, С. А. Комыхов

Харьковский государственный университет,
Харьков 310077

Поступило в редакцию 01.10.93

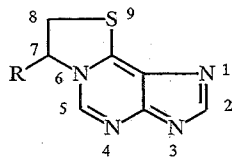
ХГС. — 1993. — № 10. — 1433.

НОВЫЙ СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 7,8-ДИГИДРОТИАЗОЛО[2,3-*i*]ПУРИНА

Производные 7,8-дигидротиазола[2,3-*i*]пурина (I) мало изучены. Описан синтез соединений I ($R = H$) реакцией 6-тиопурина с 1,2-дибром-(бромхлор)этаном [1]. Это же соединение образуется при обработке 6-(2-аминоэтил)тиопурина соляной кислотой [2]. Бромиды 1-бензил- и 3-бензил-7,8-дигидротиазола[2,3-*i*]пурина получены реакцией 7- и 9-бензил-6-тиопуринов с 1,2-дибромэтаном [3]. Сообщалось [4, 5] об образовании 7-гидроксиметилпроизводного I в результате сложных превращений 6-(2-гидрокси-3-хлорпропил)тиопурина под действием метилата натрия.

Нами разработан новый простой препаративный синтез замещенных I восстановлением доступных 6-[2-оксоалкил(аралкил)]тиопуринов $NaBH_4$ до соответствующих 6-[2-гидроксиалкил(аралкил)]тиопуринов [6] с последующей их циклизацией под действием $SOCl_2$. Выход соединений 45...90%.

Строение трициклических соединений подтверждено ИК (отсутствие полос поглощения групп OH и NH) и ПМР спектрами. Краткое сообщение об этом исследовании приведено в работе [7].



Ia-v

Ia $R = Ph$; б R = C_6H_4Br -p; в R = $C_6H_4NO_2$ -p

7-Фенил-7,8-дигидротиазола[2,3-*i*]пурин (Ia, $C_{13}H_{10}N_4S$). $T_{пл}$ 270...271 °C (разл., из ДМФА). 7-*n*-Бромфенил-7,8-дигидротиазола[2,3-*i*]пурин (Iб, $C_{13}H_9BrN_4S$). $T_{пл}$ 280...282 °C (разл., из ДМФА). 7-*n*-Нитрофенил-7,8-дигидротиазола[2,3-*i*]пурин (Iв, $C_{13}H_9N_5O_2S$). $T_{пл}$ 261...262 °C (разл., из ацетона).

Данные элементного анализа соединений на C, H, N, S, Br соответствуют вычисленным.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Balsiger R. W., Fikes A. L., Johnston T. P., Montgomery J. A. // J. Org. Chem. — 1961. — Vol. 26. — P. 3446.
2. Jonston T. P., Gallagher A. // J. Org. Chem. — 1962. — Vol. 28. — P. 1305.

3. Montgomery J. A., Balsiger R. W., Fikes A. L., Johnston T. P. // J. Org. Chem. — 1962. — Vol. 27. — P. 195.
4. Press J. B., Hajos Z. G., Sawyers R. A. // Tetrah. Lett. — 1990. — Vol. 31. — P. 1373.
5. Press J. B., McNally J. J., Hajos Z. G., Sawyers R. A. // J. Org. Chem. — 1992. — Vol. 57. — P. 6335.
6. Дунаев В. В., Александрова Е. В., Красовский А. Н., Милонова Н. П., Тишкин В. С., Линенко В. И. // Хим. -фарм. журн. — 1986. — № 10. — С. 1198.
7. Кочергин П. М., Александрова Е. В., Громов М. Ю., Попова Е. В., Палей Р. М., Скачилова С. Я., Русинова Е. В. // Тез. докл. V Всесоюз. конф. по химии азотсодерж. гетероцикл. соед. — Черноголовка, 1991. — Ч. I. — С. 79.

П. М. Кочергин, Е. В. Александрова, Е. В. Русинова

Центр по химии лекарственных средств —
Всероссийский научно-исследовательский
химико-фармацевтический институт,
Москва 119815

Поступило в редакцию 10.09.93

Запорожский медицинский институт,
Запорожье 330074

Новокузнецкий научно-исследовательский
химико-фармацевтический институт,
Новокузнецк 654034

ХТС. — 1993. — № 10. — 1434.

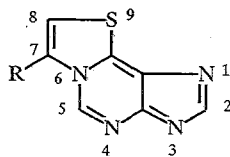
СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ НОВОЙ ГЕТЕРОАРОМАТИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ ТИАЗОЛО[2,3-*i*]ПУРИНА

Производные трициклической гетероароматической системы тиазол[2,3-*i*]пурина (III) не описаны. Известны лишь 7,8-дигидротиазоло[2,3-*i*]пурин [1] и его некоторые замещенные [2—4].

В развитие работы [5] нами осуществлен синтез соединений IIIa—в дегидратацией 7-гидрокси-7,8-дигидротиазоло[2,3-*i*]пурина (I) и 6-ацилалкилтиопуринов (IIa,б) [6, 7] под действием POCl₃, H₂SO₄ или ПФК, о чем ранее сообщалось на конференции [8].

Соединение I получено нами гидролизом диэтилацетала 6-формилметилтиопурина [9].

Строение соединений IIIa—в доказано физико-химическими методами, а строение IIIa подтверждено также восстановительной десульфуризацией до 1-этилпурина (IV) [1].



IIIa-в

III a R = H; б R = Me; в R = Ph

7-Гидрокси-7,8-дигидротиазоло[2,3-*i*]пурин (I, C₇H₆N₄OS). T_{пл} 189...190 °C (из водного ацетона). M⁺ 194. ИК спектр в вазелиновом масле: 3200...3070 (ОН), 1610, 1555 см⁻¹ (C=C, C=N). Спектр ПМР (DMSO-D₆): 8,75 (1H, с, 2-H), 8,63 (1H, с, 5-H), 6,39 (1H, м, 7-H), 3,81...3,53 м. д. (2H, м, CH₂). Выход 26%.