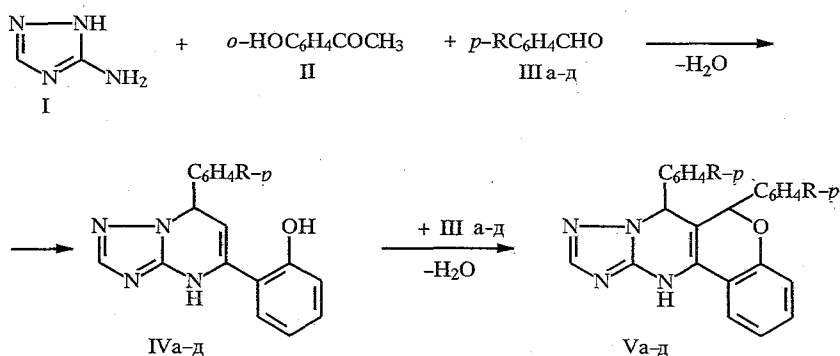


ПРОИЗВОДНЫЕ НОВОЙ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ —  
4,11-ДИГИДРО-10Н-1,2,4-  
ТРИАЗОЛО[1,5-*a*]ПИРИМИДО[6,5-*c*]БЕНЗО[*b*]ПИРАНОВ

Ранее показано, что взаимодействие 3-амино-1,2,4-триазола (I) с ароматическими альдегидами и кетонами может приводить к дигидропроизводным 1,2,4-триазоло[1,5-*a*]пиримидина [1]. Нами установлено, что при кипячении растворов амина I, *o*-оксиацетофенона (II) и бензальдегидов IIIа—д (молярное соотношение 1 : 1 : 1) в ДМФА в течение 3 ч в присутствии пиперидина наряду с небольшими (5...10%) количествами дигидротриазолопиримидинов IVа—д образуются 4,11-дигидро-10Н-1,2,4-триазоло[1,5-*a*]пиримидо[6,5-*c*]бензо[*b*]пираны Va—д. При использовании двухкратного избытка альдегидов III соединения V становятся единственными продуктами реакции.



IV, V а R = H, б R = OCH<sub>3</sub>, в R = N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, г R = F, д R = Cl

Образование соединений Va—д достигнуто также взаимодействием полученных независимым путем [2] дигидротриазолопиримидинов IV с альдегидами IIIа—д (кипячение в ДМФА 1 ч).

Соединение Va (C<sub>24</sub>H<sub>18</sub>N<sub>4</sub>O). T<sub>пл</sub> 282 °С (бензол—ДМФА, 3 : 1). ИК спектр, ν<sub>C=O</sub> (KBr) 1659 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (ДМСО-D<sub>6</sub>): 5,37 (1H, с, 11-H), 5,63 (1H, с, 10-H), 6,3...7,8 (14H, м, ArH), 7,66 (1H, с, 2-H), 10,5 м. д. (1H, с, NH). Выход 62%.

Соединение Vб (C<sub>26</sub>H<sub>22</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>). T<sub>пл</sub> 267 °С (бензол—ДМФА, 3 : 1). ИК спектр, ν<sub>C=O</sub> (KBr) 1658 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (ДМСО-D<sub>6</sub>): 3,71 (3H, с, CH<sub>3</sub>O), 3,74 (3H, с, CH<sub>3</sub>O), 5,33 (1H, с, 11-H), 5,55 (1H, с, 10-H), 6,2...7,8 (12H, м, ArH), 7,65 (1H, с, 2-H), 10,5 м. д. (1H, с, NH). Выход 61%.

Соединение Vв (C<sub>28</sub>H<sub>28</sub>N<sub>6</sub>O). T<sub>пл</sub> 289...292 °С (бензол—ДМФА, 3 : 1). ИК спектр, ν<sub>C=O</sub> (KBr) 1656 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (ДМСО-D<sub>6</sub>): 2,84 (6H, с, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>N), 2,87 (6H, с, (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>N), 5,28 (1H, с, 11-H), 5,42 (1H, с, 10-H), 6,2...7,8 (12H, м, ArH), 7,63 (1H, с, 2-H), 10,4 м. д. (1H, с, NH). Выход 58%.

Соединение Vг (C<sub>24</sub>H<sub>16</sub>N<sub>4</sub>OF<sub>2</sub>). T<sub>пл</sub> 273...276 °С (бензол—ДМФА, 3 : 1). ИК спектр, ν<sub>C=O</sub> (KBr) 1656 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (ДМСО-D<sub>6</sub>): 5,41 (1H, с, 11-H), 5,70 (1H, с, 10-H), 6,3...7,8 (12H, м, ArH), 7,67 (1H, с, 2-H), 10,5 м. д. (1H, с, NH). Выход 56%.

Соединение Vд (C<sub>24</sub>H<sub>16</sub>N<sub>4</sub>OCl<sub>2</sub>). T<sub>пл</sub> 299...301 °С (бензол—ДМФА, 3 : 1). ИК спектр, ν<sub>C=O</sub> (KBr) 1659 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (ДМСО-D<sub>6</sub>): 5,41 (1H, с, 11-H), 5,74 (1H, с, 10-H), 6,3...7,9 (12H, м, ArH), 7,67 (1H, с, 2-H), 10,5 м. д. (1H, с, NH). Выход 50%.

## 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

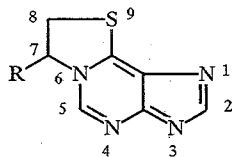
ХГС. — 1993. — № 10. — 1433.

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

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