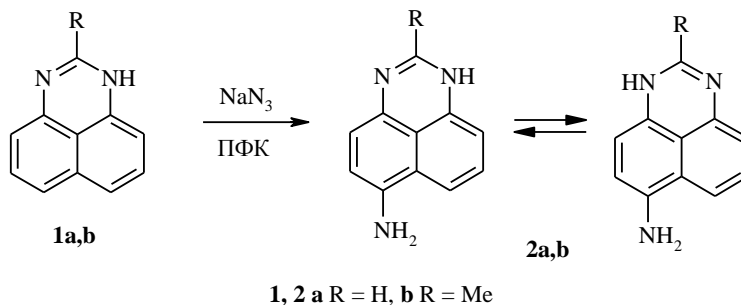


**АЗИД НАТРИЯ В ПФК – НОВАЯ СИСТЕМА РЕАГЕНТОВ ДЛЯ ЭЛЕКТРОФИЛЬНОГО
АМИНИРОВАНИЯ: СИНТЕЗ
6(7)-АМИНОПЕРИМИДИНОВ**

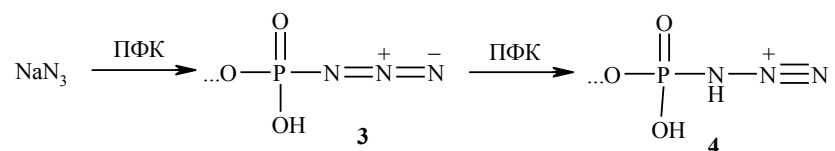
Ключевые слова: азид натрия, 6(7)-аминоперимидины, перимидины, ПФК, аминирование.

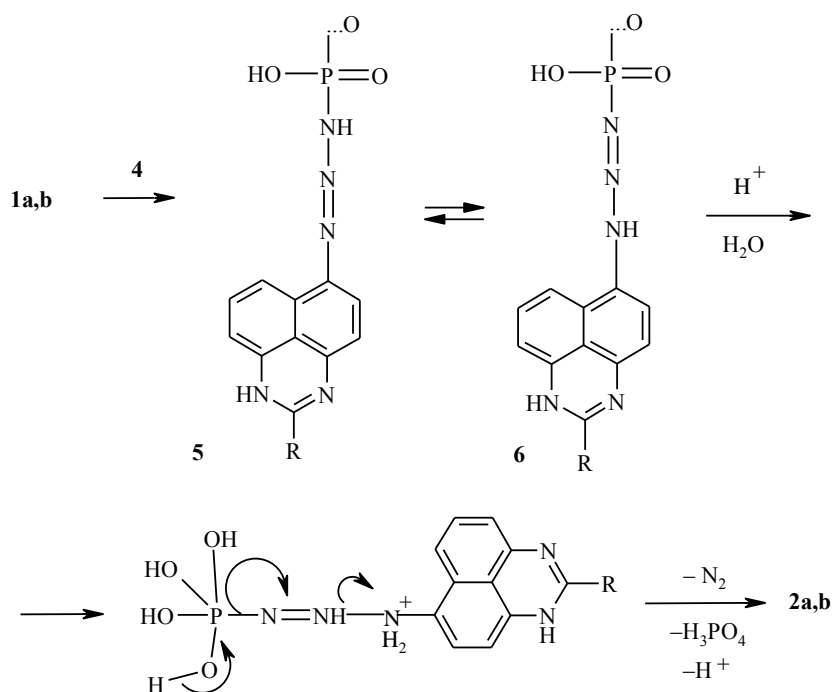
Недостатком ранее разработанного метода синтеза 6(7)-амино-2-метил-перимидина, основанного на восстановлении 6(7)-нитро-2-метилперимидина [1], является невысокий выход нитросоединений [2]. Поэтому, мы предлагаем одностадийный синтез этих соединений с использованием новой комбинации реагентов $\text{NaN}_3/\text{ПФК}$ *. Оказалось, что реакция 1 ммоль перимидинов **1a,b** и 3 ммоль NaN_3 в 2–3 г ПФК при 70–80 °С в течение 4 ч (контроль ТСХ) приводит к 6(7)-аминоперимидинам **2a,b** с выходами 62 и 69% соответственно.



* Использована ПФК с 86% содержанием P_2O_5 , полученная по методике [3].

Вероятно, реакция протекает через следующую последовательность стадий:





В результате взаимодействия азидата натрия с ПФК получается азид ПФК **3**, который в результате протонирования образует реагент **4**. Сочетание этого реагента с перимидинами **1** дает интермедиат **5**, находящийся в равновесии с соединением **6**, гидролиз которого приводит к аминам **2**.

Спектры ЯМР получали на приборе Bruker WP-200 (200 МГц) в DMSO-d_6 , внутренний стандарт ТМС. Контроль за протеканием реакций и индивидуальностью синтезированных соединений осуществляли ТСХ на пластинках Silufol UV-254, система растворителей этилацетат–спирт, 4 : 1.

Выделение соединений 2a,b (общая методика). Реакционную смесь обрабатывают 50 мл воды, подщелачивают раствором аммиака до pH 9–10. Выпавший осадок отфильтровывают. Полученные соединения очищают перекристаллизацией из этилацетата.

6(7)-Аминоперимидин (2a). Выход 0.114 г (62%). Т. пл. 261–262 °С (из этил-ацетата). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 3.30 (2H, уш. с, NH_2); 6.35 (1H, д, $J = 7.9$, H-4(9)), 6.40 (1H, д, $J = 7.3$, H-9(4)); 7.07 (1H, д, д, $J = 8.6$, $J = 7.3$, H-8(5)); 7.27 (1H, с, H-2); 7.32 (1H, д, $J = 7.9$, H-5(8)); 7.96 (1H, д, $J = 8.6$, H-7(6)); 10.44 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: С 72.68; Н 4.37; N 22.95. $\text{C}_{11}\text{H}_9\text{N}_3$. Вычислено, %: С 72.51; Н 4.43; N 23.06.

6(7)-Амино-2-метилперимидин (2b). Выход 0.136 г (69%). Т. пл. 274–275 °С (из этилацетата). Дигидрохлорид, т. пл. > 310 °С, (т. пл. > 310 °С [1]). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 2.01 (3H, с, CH_3); 3.40 (2H, уш. с, NH_2); 6.35 (2H, уш. м, H-4(9), 9(4)); 7.05 (1H, д, д, $J = 8.8$, $J = 7.3$, H-8(5)); 7.31 (1H, д, $J = 7.6$, H-5(8)); 7.91 (1H, д, $J = 8.8$, H-7(6)); 10.43 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: С 73.22; Н 5.58; N 21.20. $\text{C}_{12}\text{H}_{11}\text{N}_3$. Вычислено, %: С 73.07; Н 5.62; N 21.31.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. А. Ф. Пожарский, В. Н. Королева, И. В. Комиссаров, И. Т. Филиппов, *Хим.-фарм. журн.*, **10**, № 12, 34 (1976).
2. А. Ф. Пожарский, В. Н. Королева, *ХГС*, 550 (1975). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **11**, 486 (1975)].
3. F. Uhlig, *Angew. Chem.*, **66**, 435 (1954).

А. В. Аксенов*, А. С. Ляховненко, Н. Ц. Караиванов

*Ставропольский государственный университет,
Ставрополь 355009, Россия
e-mail: k-biochem-org@stavsui.ru*

Поступило 27.05.2009

ХГС. – 2009. – № 7. – С. 1091