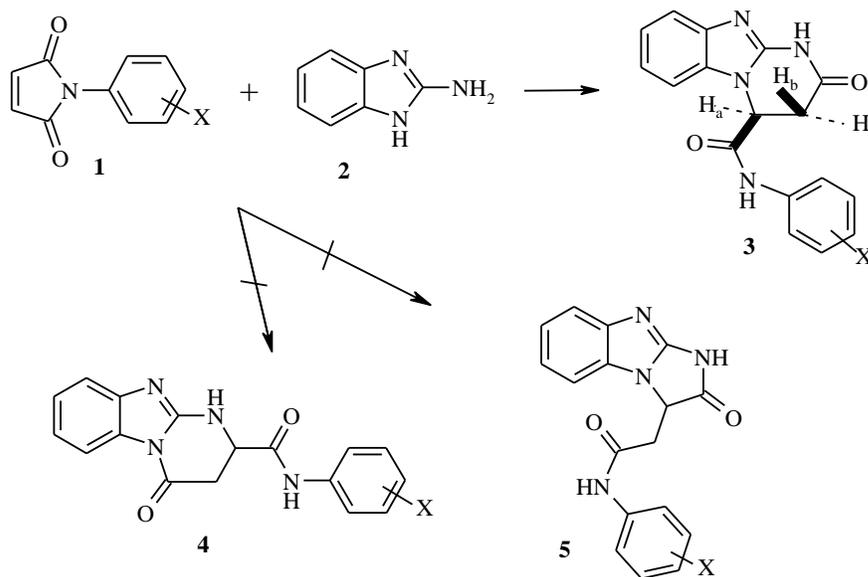


## НОВЫЙ ВАРИАНТ РЕАКЦИИ РЕЦИКЛИЗАЦИИ N-АРИЛМАЛЕИНИМИДОВ ПРИ ИХ ВЗАИМОДЕЙСТВИИ С АМИНОАЗОЛАМИ

**Ключевые слова:** 2-аминобензимидазол, 2-аминотриазол, арилмалеинимиды, рецикли-зация.

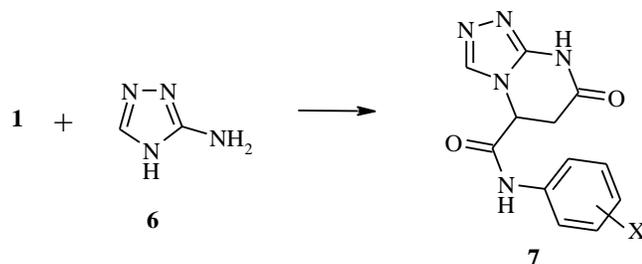
Ранее описаны реакции рециклизации N-арилмалеинимидов (**1**) при их взаимодействии с 1,2-N,N-бинуклеофилами (*o*-фенилендиамин) [1] и 1,1-N,S-бинуклеофилами (тиоамиды, тиомочевина) [2, 3]. Реакция включа- ет стадии присоединения amino- (в первом) или меркапто- (во втором случае) группы по активированной двойной связи малеинимида и раскры- тия имидного цикла с переамидированием по свободной аминогруппе бинуклеофильного субстрата. При этом, в зависимости от направления нуклеофильной атаки, возможно образование изомеров, в которых метиле- новая группа занимает *эндо*- или *экзо*-положение.

В настоящей работе рассматриваемая реакция распространена на ами- ноазолы: 2-аминобензимидазол и 2-аминотриазол, являющиеся 1,1-N,N-би- нуклеофилами. Кроме возможности образования в результате рециклиза- ции тетрагидропиримидинового или дигидроимидазольного циклов дан- ный случай осложнен вероятностью образования региоизомеров, посколь- ку нуклеофильные центры не эквивалентны.



Детальный анализ спектров ЯМР  $^1\text{H}$  позволил установить, что взаимо- действие N-(4- метоксифенил)малеинимида **1** ( $X = 4\text{-MeO}$ ) с аминобенз- имидазолом **2** приводит исключительно к 2- оксо-1,2,3,4-тетрагидробензо- [4,5]имидазо[1,2-*a*]пиримидин-4-карбокс(4-метоксианилиду) (**3**), тогда как изомерные ему соединения **4** и **5** не образуются. Этот вывод сделан на основании отнесения следующих сигналов: дублет  $H_b$  с  $\delta = 2.91$  м. д.,  $^2J_{bc} = 16.7$  Гц [4]; дублет дублетов  $H_c$  с  $\delta = 3.50$  м. д.,  $^2J_{bc} = 16.7$ ,  $^3J_{ac} = 7.8$  Гц, и дублет  $H_a$  с  $\delta = 5.37$  м. д.,  $^3J_{ac} = 7.8$  Гц ( $^3J_{ab} = 0$ ). В структуре **4** протон  $H_a$  должен быть дублетом дублетов в силу дополнительного расщепления на протоне соседней группы NH, чего не наблюдается. В структуре **5** про- тоны  $H_b$  и  $H_c$  должны быть магнитно эквивалентны.

Аналогичный анализ спектра ЯМР  $^1\text{H}$  продукта взаимодействия малеинимида **1** с аминотриазолом **6** позволил приписать ему структуру 7-оксо-5,6,7,8-тетрагидро[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-5- карбокс- (4-фторанилида) (**7**).



**2-Оксо-1,2,3,4-тетрагидробензо[4,5]имидазо[1,2-а]пиримидин-4-карбок(4-метокси-анилид) (3).** Смесь 2.03 г (10 ммоль) N-(4-метоксифенил)малеинимида и 1.33 г (10 ммоль) 2-аминобензимидазола в 10 мл диоксана кипятят 2 ч. Выпавший продукт отфильтровывают, промывают ацетоном, перекристаллизовывают из ДМФА. Выход 2.1 г (64%). Т. пл. >300 °С. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (Bruker AM 300 (300 МГц), ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.91 (1H, д,  $^2J_{bc} = 16.7$ , H<sub>b</sub>); 3.50 (1H, д, д,  $^2J_{bc} = 16.7$ ,  $^3J_{ac} = 7.8$ , H<sub>c</sub>); 3.72 (3H, с, OCH<sub>3</sub>); 5.37 (1H, д,  $^3J_{ac} = 7.8$ , H<sub>a</sub>); 6.88 (2H, д, аром.); 7.08–7.19 (2H, м, аром.); 7.48–7.56 (4H, м, аром.); 10.50 (1H, с, NH); 11.54 (1H, с, NH). Найдено, %: С 64.12; Н 4.88; N 16.50. C<sub>18</sub>H<sub>16</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 64.28; Н 4.79; N 16.66.

**7-Оксо-5,6,7,8-тетрагидро[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиримидин-5-карбок(4-фторани-лид) (7).** Смесь 1.91 г (10 ммоль) N-(4-фторфенил)малеинимида и 0.84 г (10 ммоль) 3-аминотриазола в 10 мл диоксана кипятят 2 ч. Выпавший продукт отфильтровывают, промывают ацетоном, перекристаллизовывают из ДМФА. Выход 1.98 г (72%). Т. пл. >300 °С. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (Bruker AM 300 (300 МГц), ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.87 (1H, д,  $^2J_{bc} = 3.3$ , H<sub>b</sub>); 3.34 (1H, д, д,  $^2J_{bc} = 16.5$ ,  $^3J_{ac} = 7.9$ , H<sub>c</sub>); 5.32 (1H, д,  $^3J_{ac} = 7.8$ , H<sub>a</sub>); 7.14–7.27 (2H, м, аром.); 7.55–7.68 (2H, м, аром.); 8.37 (1H, с, СН-триазол); 10.60 (1H, с, NH); 11.57 (1H, с, NH). Найдено, %: С 52.12; Н 3.78; N 25.50. C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>FN<sub>5</sub>O<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 52.37; Н 3.66; N 25.44.

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. В. Д. Романенко, Н. Е. Кульчицкая, С. И. Бурмистров, *ХТС*, 264 (1973).
2. T. Takido, S. Tamura, K. Sato, H. Kamijo, T. Nakazawa, T. Hata, M. Seno, *J. Heterocycl. Chem.*, **35**, 437 (1998).
3. М. Ю. Крысин, Х. С. Шихалиев, Д. В. Крыльский, В. В. Петров, *Органическая химия в XX веке, Тез. докл.*, Москва, Звенигород, 2000, 58.
4. А. Гордон, Р. Форд, *Спутник химика*, Мир, Москва, 1976, с. 297.

**Ю. А. Ковыгин, Д. В. Крыльский, А. В. Зорина,  
Х. С. Шихалиев**

*Воронежский государственный  
университет,  
Воронеж 394006, Россия  
e-mail: [chocd261@chem.vsu.ru](mailto:chocd261@chem.vsu.ru)*

*Поступило в редакцию 04.03.2004*