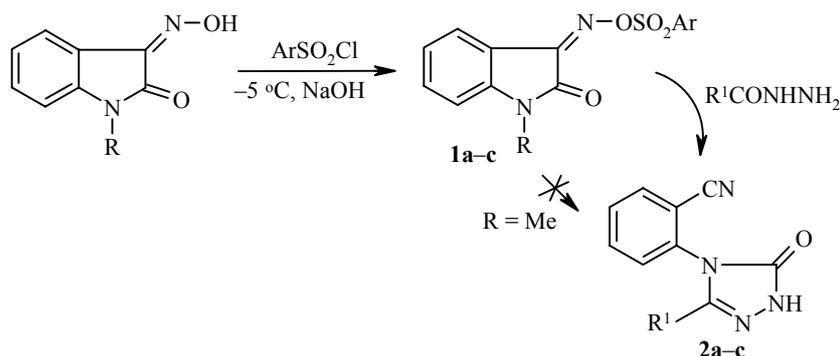


### СИНТЕЗ 3-АРИЛ(ГЕТАРИЛ)-4-(2-ЦИАНОФЕНИЛ)- $\Delta^2$ -1,2,4-ТРИАЗОЛИН-5-ОНОВ

**Ключевые слова:** О-арилсульфонильные производные 3-монооксима изатина, 3-арил(гетарил)-4-(2-цианофенил)- $\Delta^2$ -1,2,4-триазолин-5-оны.

1-Незамещенные О-арилсульфонильные производные изатин-3-оксимо в присутствии алифатических и ароматических аминов легко перегруппировываются с разрывом межкарбонильной связи с образованием N-(2-цианоарил)-N'-R-карбамидов [1]. Предполагая, что при реакции с замещенными гидразинами будут образовываться соответствующие семикарбазиды, мы исследовали реакцию арилсульфонатов **1a–c** с гидразидами карбоновых кислот. При этом мы установили, что даже в сравнительно мягких условиях (непродолжительное нагревание компонентов в диоксане в присутствии триэтиламина) с достаточно высокими выходами образовались соединения с молекулярными массами, на 18 меньше ожидавшихся для соответствующих семикарбазидов. Это указывало на то, что в условиях реакции протекала циклодегидратация соединений **1a–c** с образованием 3-арил(гетарил)-5-оксо(4Н)-4-(2-цианофенил)-1,2,4-триазолинов **2a–c**.



**1 a, b** R = H, **c** R = Me, **a** Ar = Ph, **b, c** Ar = *p*-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>;  
**2 a** R<sup>1</sup> = *p*-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, **b** R<sup>1</sup> = 4-Py, **c** R<sup>1</sup> = Ph

Действительно, в их масс-спектрах пики молекулярных ионов имели максимальную интенсивность, что указывало на циклическое строение соединений, а процессы фрагментации были связаны в основном с элиминированием преимущественно молекул CO, 2-NCC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>NCO, а также R'<sup>1</sup>CN (*m/z* 159), что не было бы возможным в случае линейной структуры. Следует отметить, что N-замещенный тозилат **1c** не реагировал с использованными гидразидами, что позволяет предположить образование в условиях реакции высокоактивных интермедиатов 2-цианофенилизоцианатов. Исследования продолжаются.

**3-(4-Метоксифенил)-4-(2-цианофенил)- $\Delta^2$ -1,2,4-триазолин-5-он (2a).** Смесь 3.02 г (10 ммоль) О-бензолсульфоната **1a** [1], 3.32 г (20 ммоль) гидразида *n*-метоксибензойной кислоты, 1 мл триэтиламина в 10 мл диоксана нагревают 45 мин. После охлаждения до комнатной температуры смесь разбавляют 20 мл воды, вещество отфильтровывают, промывают водой и перекристаллизовывают из уксусной кислоты с активированным углем. Получают 1.2 г (41%) триазинона **2a**, т. пл. 302–303 °С. Масс-спектр, *m/z* (*I*, %): 292 [M]<sup>+</sup> (100), 277 [M–CH<sub>3</sub>]<sup>+</sup> (7), 264 [M–CO]<sup>+</sup> (6), 148 [M–144]<sup>+</sup> (11), 144 [2-NCC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>NCO]<sup>+</sup> (7), 133 [R<sup>1</sup>CN]<sup>+</sup> (16), 119 (5), 105 (4), 103 (4), 90 (4), 76 (5).

**3-(4-Пиридил)-4-(2-цианофенил)- $\Delta^2$ -1,2,4-триазолин-5-он (2b)** получают аналогично из 3.02 г (10 ммоль) бензолсульфоната **1a**, 1.5 г (11 ммоль) гидразида изоникотиновой кислоты и 2 мл триэтиламина в 10 мл диоксана. Смесь кипятят 10 мин и получают 1.1 г (42%) соединения **2a**, т. пл. >300 °С (из уксусной кислоты). Масс-спектр, *m/z* (*I*, %): 263 [M]<sup>+</sup> (100), 159 [M–R<sup>1</sup>CN]<sup>+</sup> (4), 144 [2-NCC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>NCO]<sup>+</sup> (8), 131 [M–R<sup>1</sup>CN–CO]<sup>+</sup> (17), 119 [M–144]<sup>+</sup> (70), 104 [R<sup>1</sup>CN]<sup>+</sup> (7), 103 (10), 92 (10), 91 (9), 78 (24), 76 (11), 50 (17).

**3-Фенил-4-(2-цианофенил)- $\Delta^2$ -1,2,4-триазолин-5-он (2c)** получают аналогично кипячением смеси 3.16 г (10 ммоль) тозилата **1b** [1], 1.5 г (11 ммоль) гидразида бензойной кислоты и 2 мл триэтиламина в 10 мл диоксана в течение 45 мин. Выход 1.2 г (46%), т. пл. >300 °С (из диоксана). Масс-спектр, *m/z* (*I*, %): 262 [M]<sup>+</sup> (100), 234 [M–CO]<sup>+</sup> (6), 159 [M–R<sup>1</sup>CN]<sup>+</sup> (3), 144 [2-NCC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>NCO]<sup>+</sup> (3), 131 [M–R<sup>1</sup>CN–CO]<sup>+</sup> (6), 118 [M–144]<sup>+</sup> (70), 103 [R<sup>1</sup>CN]<sup>+</sup> (15), 91(14), 89(10), 77(11), 76(10).

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. А. П. Станкявичюс, П. Б. Терентьев, Л. Н. Янушене, П. В. Вайнаускас, *ХГС*, 2003, № 12 (в печати).

А. П. Станкявичюс, П. Б. Терентьев<sup>а</sup>, Л. Н. Янушене,  
А. А. Жевжиковене<sup>б</sup>

*Институт кардиологии,  
Каунасский медицинский университет,  
Каунас 3007, Литва  
e-mail: carsynt@ktu.lt*

*Поступило в редакцию 23.10.2003*

<sup>а</sup>*Химический факультет  
Московского государственного  
университета им. М. В. Ломоносова,  
Москва 119899, Россия  
e-mail: petr@ms-bioorg.chem.msu.ru*

<sup>б</sup>*Каунасский медицинский университет,  
Каунас 3000, Литва  
e-mail: vpaul@ktu.lt*

*ХГС. – 2003. – № 11. – С. 1731*