

3-Фенил-3,4-дигидробензо[4,5]имидазо[2,1-*f*][1,2,4]триазин (2). Смесь 0.15 г (0.63 ммоль) соединения **1** и 2 мл этилового эфира ортомуравьиной кислоты нагревают 8 ч при температуре 100 °С. В охлажденную реакционную смесь прибавляют каплю конц. H₂SO₄. Выделившийся кристаллический осадок отфильтровывают, промывают этанолом, перекристаллизовывают из ДМФА и получают 0.09 г (58%) соединения **2**, т. пл. 245 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д.: 5.28 (2H, с, CH₂); 7.10–7.74 (9H, м, ArH); 8.01 (1H, с, CH). Найдено, %: С 72.68, Н 4.56, N 22.35. C₁₅H₁₂N₄. Вычислено, %: С 72.56, Н 4.87, N 22.57.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. V. Garalienė, A. Brukštus, L. Labanauskas, V. Daukšas, *Arzneim.-Forsch./Drug Res.*, **48(II)**, 1137 (1998).
2. L. Labanauskas, A. Brukštus, E. Udrėnaitė, P. Gaidelis, V. Bučinskaitė, V. Daukšas, *Die Pharmazie*, **55**, 429 (2000).
3. E. M. Essassi, J. Fifi, I. Hamamsi, *Bull. Soc. Chim. Belg.*, **103**, 83 (1994).

**Л. Лабанаускас, В. Бучинскайте, А. Брукштус,
Г. Урбялис**

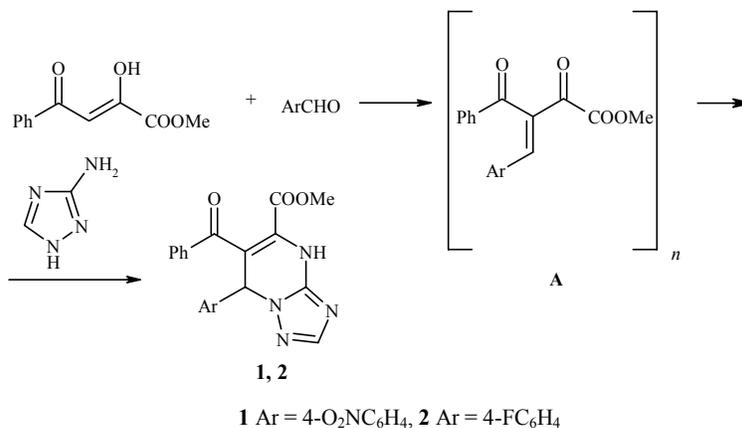
Вильнюсский университет,
кафедра органической химии,
Вильнюс 2006, Литва
e-mail: linas.labanauskas@chf.vu.lt

Поступило в редакцию 22.04.2003

СИНТЕЗ 4-АРИЛ-3-БЕНЗОИЛ-2-МЕТОКСИКАРБОНИЛ-1,4-ДИГИДРОПИРИМИДО[1,2-*b*]ТРИАЗОЛОВ

Ключевые слова: 3-амино-1,2,4-триазол, 4-арил-3-бензоил-2-метокси-карбонил-1,4-дигидропиримидо[1,2-*b*]триазол, метиловый эфир бензоил-пировиноградной кислоты.

Нами обнаружено, что сплавление при 115–130 °С метиловых эфиров бензоилпировиноградных кислот с 3-амино-1,2,4-триазолом в присутствии ароматического альдегида приводит к 4-арил-3-бензоил-2-метокси-карбонил-1,4-дигидропиримидо[1,2-*d*]триазолам (**1**, **2**).



Соединения **1**, **2** – бесцветные кристаллические вещества, легко растворимые в ДМСО, ДМФА, при нагревании растворимые в спирте, уксусной кислоте, диоксане, нерастворимые в воде.

По-видимому, на первой стадии реакции образуется неопределённое соединение **A**, взаимодействие с которым 3-амино-1,2,4-триазола приводит к соединениям **1**, **2**. Структура последних подтверждена данными ЯМР ^1H , ИК спектров и масс-спектрометрии.

ИК спектры получали на приборе UR-20, спектры ЯМР ^1H – на спектрометре Bruker DRX 500 (500 МГц) в ДМСО- d_6 . Масс-спектры снимали на приборе MX-1320, энергия ионизирующих электронов 70 эВ.

3-Бензоил-2-метоксикарбонил-4-(4-нитрофенил)-1,4-дигидропиримидо[1,2-*b*]триазол (1). Смесь 0.01 моль метилового эфира бензоилпировиноградной кислоты, 0.01 моль 4-нитробензальдегида и 0.01 моль 3-амино-1,2,4-триазола сплавляют на металлической бане при 115–130 °С до прекращения выделения газа, охлаждают, обрабатывают этанолом, осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают. Выход 1.55 г (38%), т. пл. 200–202 °С (из EtOH). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1665 (CO), 1740 (COOMe), 3220 (NH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 3.21 (3H, с, OMe); 6.73 (1H, с, C₄H); 7.40–8.16 (9H, м, аром); 7.78 (1H, с, C₆H); 11.35 (1H, с, NH). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): $[\text{M}]^+$ 405 (33.80). Найдено, %: C 59.25, 59.18; H 3.73, 3.65; N 17.27, 17.32. C₂₀H₁₅N₅O₅. Вычислено, %: C 59.30; H 3.71; N 17.40.

3-Бензоил-2-метоксикарбонил-4-(4-фторфенил)-1,4-дигидропиримидо[1,2-*b*]триазол (2) получают аналогично. Выход 1.35 г (36%), т. пл. 222–224 °С (из EtOH). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1645 (CO), 1730 (COOCH₃), 3200 (NH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 3.23 (3H, с, OMe); 6.55 (1H, с, C₄H); 7.08–7.56 (9H, м, аром.); 7.75 (1H, с, C₆H); 11.15 (1H, с, NH). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): $[\text{M}]^+$ 378 (44.48). Найдено, %: C 63.51, 63.48; H 3.99, 4.02; N 14.80, 14.72. C₂₀H₁₅FN₄O₃. Вычислено, %: C 63.55; H 4.00, N 14.85.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (грант № 02-03-96415).

В. Л. Гейн, Л. Ф. Гейн^а, Е. П. Цыплякова

Пермская государственная фармацевтическая академия, Пермь 614990, Россия
e-mail: pba@degasot.ru

Поступило в редакцию 24.02.2003

^аПермская государственная медицинская академия, Пермь, Россия 614000

ХГС. – 2003. – № 6. – С. 949

4-АМИНО-6-(*трет*-БУТИЛ)-3-МЕТИЛТИО-4,5-ДИГИДРО-1,2,4-ТРИАЗИН-5-ОН В РЕАКЦИЯХ НУКЛЕОФИЛЬНОГО ЗАМЕЩЕНИЯ С ГИДРАЗИДАМИ КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Ключевые слова: 8-амино-6-(*трет*-бутил)-3-арил-7,8-дигидро[1,2,4]триазоло[4,3-*b*][1,2,4]триазин-7-он, 4-амино-6-(*трет*-бутил)-3-метилтио-4,5-дигидро-1,2,4-триазин-5-он, нуклеофильное замещение.

Известные методы синтеза производных [1,2,4]триазоло[4,3-*b*]-[1,2,4]триазина основаны на взаимодействии 3-гидразино-4,5-дигидро-[1,2,4]триазин-5-она с карбоновыми кислотами [1, 2], ортомуравьиным эфиром [3], бромцианом [4] или ароматическими изотиоцианатами [5].