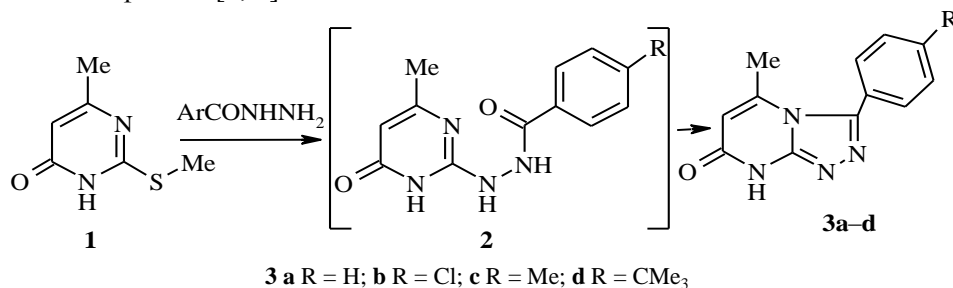


**СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ  
[1,2,4]ТРИАЗОЛО[4,3-*a*]ПИРИМИДИН-7(8Н)-ОНА  
НУКЛЕОФИЛЬНЫМ ЗАМЕЩЕНИЕМ МЕТИЛМЕРКАПТО-  
ГРУППЫ 4-ГИДРОКСИ-6-МЕТИЛ-2-МЕТИЛТИОПИРИМИДИНА**

**Ключевые слова:** 4-гидрокси-6-метил-2-метилмеркаптопиримидин, [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-он, нуклеофильное замещение, спонтанная циклизация.

Триазолопиримидины проявляют противовоспалительную [1], сосудорасширяющую [2] и бактерицидную [3] активности.

Ранее нами было показано [4], что при кипячении 2-арилиденгидразонов 4-гидрокси-6-метилпиримидинов в нитробензоле образуются производные [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-она. Одним из описанных в литературе методов получения данной системы является взаимодействие 4-гидрокси-6-метил-2-метилтиопиримидина (**1**) с гидразидами карбоновых кислот в феноле [5, 6].



Нами найдено, что при сплавлении (200 °С) эквимольных количеств соединения **1** и гидразидов ароматических кислот реакция нуклеофильного замещения не заканчивается образованием 2-бензоилгидразинов 4-гидрокси-6-метилпиримидина (**2**), а происходит спонтанная циклизация с образованием производных 3-арил-5-метил[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-онов (**3**). Спектр ЯМР соединения **3b** полностью идентичен со спектром соединения, полученного методом окислительной циклизации 2-(4-хлорбензилиден)гидразона 4-гидрокси-6-метилпиримидина в нитробензоле [4].

Строение синтезированных соединений подтверждено данными спектроскопии ЯМР <sup>1</sup>H (300 МГц, ДМСО-*d*<sub>6</sub>/TMS).

**5-Метил-3-фенил[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-он (3a).** Смесь 0.01 моль соединения **1** и 0.01 моль гидразида бензойной кислоты нагревают в течение 1 ч при 200 °С. По охлаждении реакционную смесь растирают в пропаноле-2, отфильтровывают и сушат. Выход 78%. Т. пл. >300 °С (из ДМФА). ИК спектр, ν, см<sup>-1</sup> (таблетки KBr): 1610 (C=N); 1685 (C=O). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д.: 2.34 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 5.69 (1H, с, CH); 7.43–8.14 (5H, м, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>); 12.97 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: N 24.7. C<sub>12</sub>H<sub>10</sub>N<sub>4</sub>O. Вычислено, %: N 24.8.

**5-Метил-3-(4-хлорфенил)[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-он (3b)** получают аналогично соединению **3a** из эквимольных количеств пиримидина **1** и гидразида 4-хлорбензойной кислоты. Выход 79%. Т. пл. >300 °С (из ДМФА). ИК спектр, ν, см<sup>-1</sup> (таблетки KBr): 1600 (C=N); 1675 (C=O). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д.: 2.34 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 5.85 (1H, с, CH); 7.56 и 8.11 (4H, д. д, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>); 13.2 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: N 21.3; Cl 13.3. C<sub>12</sub>H<sub>8</sub>ClN<sub>4</sub>O. Вычислено, %: N 21.5; Cl 13.6.

**5-Метил-3-(4-метилфенил)[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8Н)-он (3c)** получают аналогично соединению **3a** из эквимольных количеств пиримидина **1** и гидразида 4-метилбензойной кислоты. Выход 83%. Т. пл. >300 °С (из ДМФА). ИК спектр, ν, см<sup>-1</sup> (таблетки KBr): 1600 (C=N); 1675 (C=O). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д.: 2.33 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.37

(3H, с, CH<sub>3</sub>); 5.84 (1H, с, CH); 7.33 и 8.99 (4H, д. д, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>); 13.2 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: N 23.5. C<sub>13</sub>H<sub>12</sub>N<sub>4</sub>O. Вычислено, %: N 23.3.

**3-(4-*tert*-Бутилфенил)-5-метил[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиримидин-7(8H)-он (3d)** получают аналогично соединению **3a** из эквимольных количеств пиримидина **1** и гидразида 4-*tert*-бутилбензойной кислоты. Выход 81%. Т. пл. >300 °С (из ДМФА). ИК спектр, ν, см<sup>-1</sup> (таблетки KBr): 1600 (C=N); 1675 (C=O). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д.: 1.31 (9H, с, CH<sub>3</sub>); 2.04 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 5.53 (1H, с, CH); 7.51 и 7.88 (4H, д. д, C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>); 10.2 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: N 20.2. C<sub>16</sub>H<sub>17</sub>N<sub>4</sub>O. Вычислено, %: N 19.9.

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. N. Mori, M. Kaneko, Y. Torii, T. Takahashi, T. Imaoka, K. Tanida, PCT Int. Appl. WO 00 34.278; *Chem. Abstr.*, **133**, 43533 (2000).
2. Ren Tian-Rui, Chen Fu-Heng, Zhou Jia-Ju, Chen Hong-Ming, Guo Zong-Ru, *J. Chin. Pharm. Sci.*, **7(4)**, 171 (1998); *Chem. Abstr.*, **127**, 223237 (1999).
3. V. J. Ram, P. Srivastava, S. K. Sing, M. Kandpal, B. L. Tekwani, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **7**, 1087 (1997); *Chem. Abstr.*, **130**, 50601 (1999).
4. В. А. Янченко, А. М. Демченко, *ХГС*, 850 (2002).
5. C. F. H. Allen, G. A. Reynolds, J. F. Tinker, L. A. Williams, *J. Org. Chem.*, **25**, 361 (1960).
6. C. F. H. Allen, H. R. Veifuss, D. M. Burness, G. A. Reynolds, J. F. Tinker, J. A. VanAllan, *J. Org. Chem.*, **24**, 793 (1959).

**В. А. Янченко, А. Н. Гурьева, А. Р. Хайрулин, А. М. Демченко**

Черниговский государственный педагогический  
университет им. Т. Г. Шевченко,  
Чернигов 14038, Украина  
e-mail: [demch@cn.relc.com](mailto:demch@cn.relc.com)

Поступило в редакцию 27.04.2002

ХГС. – 2002. – № 9. – С. 1296