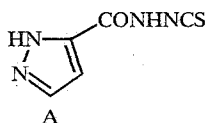


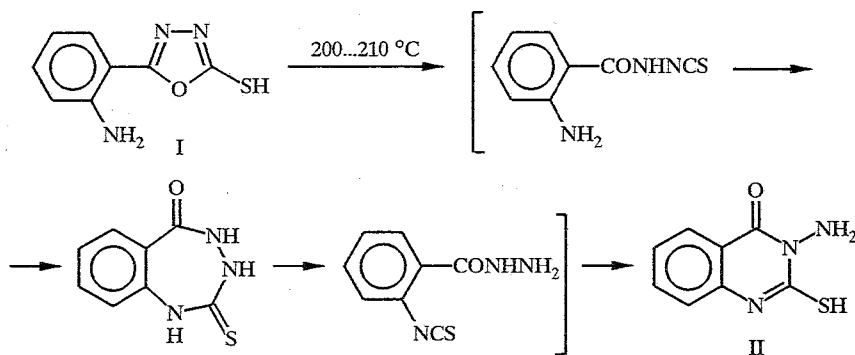
ПИСЬМА В РЕДАКЦИЮ

О РЕЦИКЛИЗАЦИИ
5-(2-АМИНОФЕНИЛ)-1,3,4-ОКСАДИАЗОЛТИОНА-2
В ПРОИЗВОДНЫЕ ХИНАЗОЛИНА

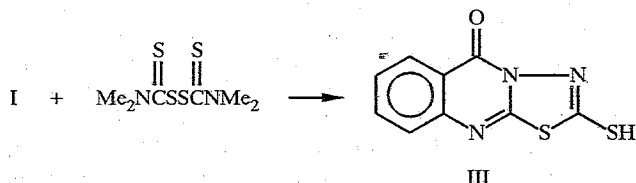
Известна термическая рециклизация 2-меркапто-5-(3(5)-пиразолил)-1,3,4-оксадиазола, приводящая к 7-меркаптопиразоло[1,5-*d*]-*as*-триазин-4(5H)-ону [1]. Предполагается, что эта реакция осуществляется через промежуточный продукт (А), возникающий в результате размыкания оксадиазольного цикла.



Мы нашли, что 5-(2-аминофенил)-1,3,4-оксадиазолтион-2 (I) при 200...210 °С количественно переходит в 3-амино-2-меркаптохиназолин-4(3H)-он (II) через серию последовательных перегруппировок:

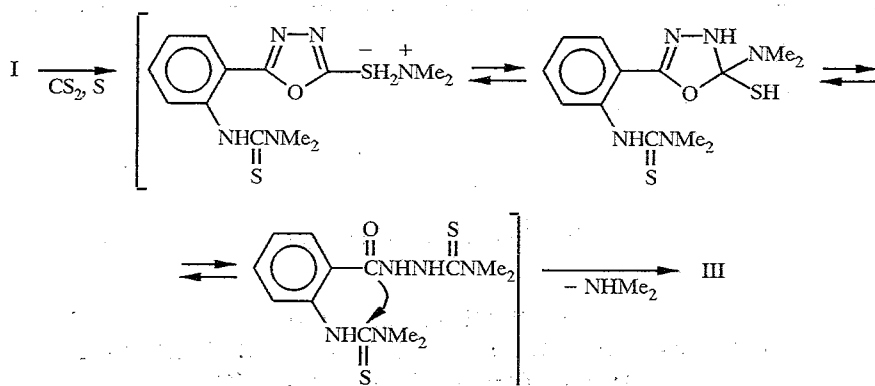


а при реакции же тиона I с тетраметилтиурамдисульфидом (ТМТД) — в 2-меркапто-1,3,4-тиадиазоло[2,3-*b*]хиназолин-5-он (III):



Соединения II и III идентичны с веществами, синтезированными по методике [2]; их строение подтверждено данными ИК и ПМР спектроскопии.

Для последнего процесса предложена следующая схема превращения I в III:



3-Амино-2-меркаптохиназолин-4(3H)-он (I). Нагревают при 200...210 °С в запаянной ампуле 0,865 г (0,005 моль) 5-(2-аминофенил)-1,3,4-оксадиазолтиона-2 в течение 0,5 ч. После охлаждения смеси продукт растворяют в 20 мл 2% раствора КОН и осаждают концентрированной уксусной кислотой. Получают 0,81 г (94%) II. $T_{пл}$ 239...240 °С. ИК-спектр (в вазелине): 3305 (NHас), 3272 (NH), 3225 (NHс), 1700, 1678 (C=O), 1640 cm^{-1} (C=N). Спектр ПМР (ДМСО- D_6): 8,07...7,33 (4H, м, SH), 6,39 (2H, с, NH₂), 3,46 м. д. (1H, с, SH).

2-Меркапто-1,3,4-тиадиазоло[2,3-*b*]хиназолин-5-он (III). Реакционную смесь, состоящую из 1,93 г (0,01 моль) I и 2,40 г (0,01 моль) ТМТД, в 6 мл ДМФА нагревают 1 ч при 100 °С, выливают в 50 мл 2% раствора КОН, отфильтровывают выпавшую серу и подкисляют концентрированной соляной кислотой. Продукт отфильтровывают, промывают на фильтре водой и сушат. Получают 2,28 г (97%) III. $T_{пл}$ 300 °С. ИК спектр (в вазелине): 3335 (NH), 2630 (SH), 1730 (C=O), 1640 cm^{-1} (д, C=N).

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Ainsworth C. // J. Amer. Chem. Soc. — 1956. — Vol. 78. — P. 4475.
2. Pathac U. S., Devani M. V. // Indian J. Chem. — 1986. — Vol. B25. — P. 489.

Г. Г. Русу, Д. Коваль, Я. Е. Гуцу, Н. А. Барба

Государственный университет Республики
Молдова, Кишинэу 277009

Поступило в редакцию 23.05.95

СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 2-АРИЛ-1,5-ДИГИДРО-1-АЗАПИРЕНА

Алифатические амины реагируют с эпоксиенонами с образованием 3-гидроксипиперидин-4-онов или 3-гидрокси-3-ацетилпирролидинов [1]. При этом на первой стадии процесса, в зависимости от природы растворителя, образуется аддукт амина либо по двойной связи, либо по эпоксидному циклу (в результате его раскрытия) [2]. Подобным образом ведет себя в условиях данной реакции и анилин [3]. Нами обнаружено, что с β -нафтиламином в уксусной кислоте реакция эпоксиенонов (Ia—г) протекает более глубоко и приводит исключительно к 2-арил-1,5-дигидро-1-азапиренам. Предполагаемый механизм образования этих соединений включает стадии присоединения амина по двойной связи эпоксиенона и последующей конденсации—алкилирования фрагмента эпоксиенона с участием карбонильной группы и эпоксидного цикла.