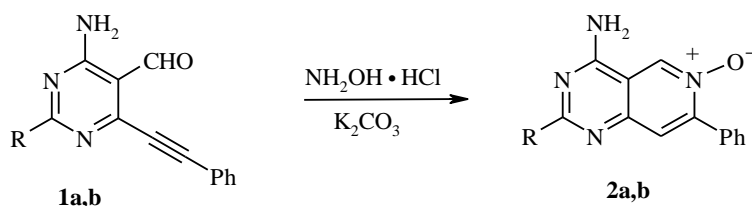


СИНТЕЗ 4-АМИНО-7-ФЕНИЛПИРИДО[4,3-*d*]ПИРИМИДИН-6-ОКСИДОВ

Ключевые слова: арилэтинилпиримидины, пиридо[4,3-*d*]пиримидины, циклизация.

Недавно в нашей лаборатории были синтезированы некоторые алкилпроизводные пиримидина и показано их применение для получения пирроло[3,2-*d*]пиримидин-7-оксидов [1, 2] и пиридо[4,3-*d*]пиримидинов [3] соответственно. Продолжая исследования в этом направлении, мы представляем простой синтез ранее не известных 4-амино-7-фенилпиридо[4,3-*d*]пиримидин-6-оксидов. Последние соединения могут служить хорошими синтонами полизамещенных пиридо[4,3-*d*]пиримидинов, которые привлекают интерес благодаря своей биологической активности [4–6].

Кипячение 6-(фенилэтинил)пиримидин-5-карбальдегидов **1a,b** с гидрохлоридом гидроксиламина в присутствии карбоната калия в смеси этанол–вода приводит к образованию 4-амино-7-фенилпиридо[4,3-*d*]пиримидин-6-оксидов **2a,b** с выходами 90 и 82% соответственно.



1, 2 a R = SCH₃, b R = NH₂

ИК спектры получены на спектрометре FT-IR Spectrum BX II (Perkin–Elmer), а спектры ЯМР ¹H и ¹³C – на приборе Varian Unity Inova (300 и 75 МГц соответственно) в ДМСО-*d*₆, внутренний стандарт ТМС.

Исходные 4-амино-6-(фенилэтинил)пиримидин-5-карбальдегиды **1a,b** синтезированы по методу, приведенному в работе [3].

4-Амино-2-метилтио-7-фенилпиридо[4,3-*d*]пиримидин-6-оксид (2a). Раствор 0.2 г (0.74 ммоль) 4-амино-2-метилтио-6-(фенилэтинил)пиримидин-5-карбальдегида **1a**, 0.06 г (0.86 ммоль) гидрохлорида гидроксиламина и 0.057 г (0.37 ммоль) карбоната калия кипятят 10 ч в 10 мл 50% этанола, охлаждают, выделившийся осадок отфильтровывают, перекристаллизовывают из смеси этанол–вода и получают 0.21 г (90%) соединения **2a**, т. пл. 260 °С. ИК спектр (вазелиновое масло), ν , см⁻¹: 3324, 3305 (NH₂), 1242 (NO). Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д.: 2.50 (3H, с, SCH₃); 7.46–7.48 (3H, м, ArH); 7.52 (1H, с, CH); 7.79–7.83 (2H, м, ArH); 8.05 (2H, ш. с, NH₂); 9.34 (1H, с, CH). Спектр ЯМР ¹³C, δ , м. д.: 13.2, 109.5, 122.6, 127.4, 129.1, 129.2, 132.2, 134.4, 146.0, 151.8, 157.6, 170.3. Найдено, %: С 58.99; Н 4.15; N 19.79. С₁₄H₁₂N₄OS. Вычислено, %: С 59.14; Н 4.25; N 19.70.

2,4-Диамино-7-фенилпиридо[4,3-*d*]пиримидин-6-оксид (2b). Синтезируют аналогично соединению **2a**, перекристаллизовывают из смеси 2-пропанол–ДМСО, выход 82%, т. пл. > 300 °С. ИК спектр (вазелиновое масло), ν , см⁻¹: 3402, 3385, 3324, 3305 (NH₂), 1243 (NO). Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д.: 6.89 (2H, ш. с, NH₂); 7.42–7.45 (3H, м, ArH); 7.53 (1H, с, CH); 7.82–7.86 (2H, м, ArH); 8.10 (2H, ш. с, NH₂); 9.18 (1H, с, CH). Найдено, %: С 61.58; Н 4.61; N 27.70. С₁₃H₁₁N₅O. Вычислено, %: С 61.65; Н 4.38; N 27.65.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. I. Susvilo, A. Brukstus, S. Tumkevicius, *Synlett*, 1151 (2003).
2. С. Тумкявичюс, И. Сусвило, А. Брукштус, *XTC*, 1546 (2004). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **40**, 1335 (2004)].
3. И. Сусвило, Р. Палските, С. Тумкявичюс, А. Брукштус, *XTC*, 298 (2005). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **41**, 268 (2005)].
4. A. M. Thompson, D. K. Muray, W. L. Elliot, D. W. Fry, J. A. Nelson, H. D. H. Showalter, B. J. Roberts, P. W. Vincent, W. A. Denny, *J. Med. Chem.*, **40**, 3915 (1997).
5. J. B. Smail, B. D. Palmer, G. W. Rewcastle, W. A. Denny, D. J. McNamara, E. M. Dobrusin, A. J. Bridges, H. Zhou, H. D. H. Showalter, R. T. Winters, W. R. Leopold, D. W. Fry, J. M. Nelson, V. Slintak, W. L. Elliot, B. J. Roberts, P. W. Vincent, S. J. Patmore, *J. Med. Chem.*, **42**, 1803 (1999).
6. M. D. Meyer, R. J. Altenbach, H. Bai, F. Z. Basha, W. A. Carroll, J. F. Kerwin, S. A. Lebold, E. Lee, J. K. Pratt, K. B. Sippy, K. Tietje, M. D. Wendt, M. E. Brune, S. A. Buckner, A. A. Hancock, I. Drizin, *J. Med. Chem.*, **44**, 1971 (2001).

И. Чикотене, Р. Букшнайтене, А. Брукштус

Вильнюсский университет,
Кафедра органической химии,

Поступило 03.11.2006

Вильнюс LT-03225, Литва
e-mail: inga.cikotiene@chf.vu.lt

ХГС. – 2007. – № 4. – С. 619
