

СИНТЕЗ 1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-АМИНОВ КОНДЕНСАЦИЕЙ ЦИАНАМИДОВ С АЦИЛГИДРАЗИДАМИ

Юдин Н.Е., Перелевская С.А., Шестаков А.С.

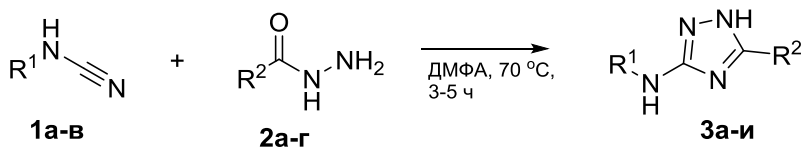
Воронежский государственный университет
394018, г. Воронеж, Университетская пл., д. 1

Использование цианамидов в конденсации с гидразидами позволяет в мягких условиях с хорошими выходами получать целевые аминотриазолы.

Исходные цианамиды были получены следующим образом: 4,6-диметилпиримидин-2-ил цианамид **1а** – конденсацией ацетилаcetона с цианогуанидином, бензоилцианамид **1б** – взаимодействием бензоилхлорида с тиоцианатом калия, фенилцианамид **1в** – десульфуризацией фенилтиокарбамида.

Исходные гидразиды (кроме изониазида) получены взаимодействием соответствующих эфиров карбоновых кислот с гидразингидратом.

Нагревание гидразидов с цианамидами в ДМФА при 70 °С в течение 3-5 часов приводит к образованию триазолов **3**, выпадающих в осадок. Выходы составляют 45-65% при использовании 4,6-диметилпиримидин-2-илцианамид **1а**, 30-50% при использовании бензоилцианамид **1б** и около 30% при использовании фенилцианамид **1в**.



1: R¹ = 4,6-диметилпиримидин-2-ил (**а**), Bz (**б**), Ph (**в**);

2: R² = Ph (**а**), 4-Ру (**б**), Me (**в**), 2-нафтил-ОСН₂ (**г**);

3: R¹ = 4,6-диметилпиримидин-2-ил, R² = Ph (**а**), 4-Ру (**б**), Me (**в**), R¹ = Bz, R² = Ph (**г**), 4-Ру (**д**), 2-нафтил-ОСН₂ (**е**), R¹ = Ph, R² = Ph (**ж**), 4-Ру (**з**), 2-нафтил-ОСН₂ (**и**).

Очистка выпадающего в осадок продукта заключается в промывании осадка 1% раствором NaOH и водой до нейтральной реакции, что позволяет избавиться от примесей исходных цианамид и гидразида.

Особенностью цианамидов является наличие подвижного протона при атоме азота аминогруппы, что обуславливает их кислотные свойства. Можно предположить, что на первой стадии цианамид и гидразид взаимодействуют по кислотно-основному механизму с образованием соответствующей соли, которая при нагревании претерпевает перегруппировку Велера с образованием ацилгуанидина, циклизующегося в аминотриазол. Использование ДМФА для подобного рода превращений является оптимальным.