

6-Аминотриазоло[1,5-а]пиримидины как предшественники 1,2,4-триазоло [5,1-б]пуринов

Саватеев К.В., Борисов С.С., Воинков Е.К.,
Уломский Е.Н., Русинов В.Л., Чупахин О.Н.

ФГАОУ ВПО «УрФУ имени первого Президента России Б.Н.Ельцина»

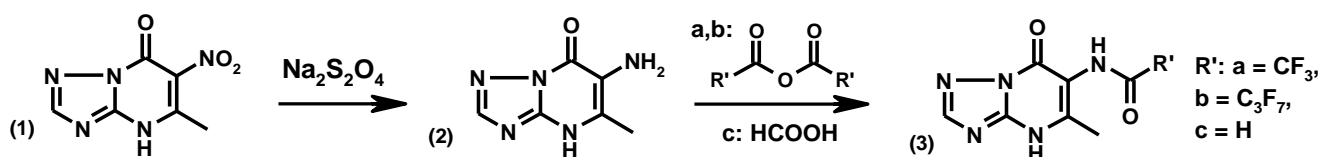
Триазоло[5,1-б]пурины являются малораспространенными структурными аналогами природных нуклеозидов и нуклеиновых оснований пуринового ряда. В то же время, известные представители азолопуринов проявляют широкий спектр противовирусного действия, активность в отношении ревматоидного артрита, псориаза, болезней Альцгеймера, Паркинсона и проч. Несмотря на практическую ценность, азоло[5,1-б]пурины чрезвычайно скупо представлены в химической литературе, что обусловлено сложностью их синтеза. Нами предложен удобный путь к синтезу триазолопуринов с участием аминотриазоло[1,5-а]пиримидинов (2) в качестве доступных исходных соединений, получаемых с хорошими выходами восстановлением нитропроизводных (1).

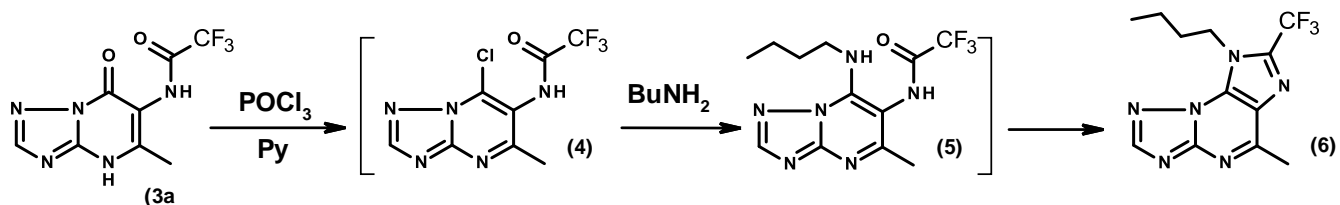
Традиционно одним из наиболее распространенных способов превращения азинонов в аминоазины является хлордезоксигенирование гетероциклов с последующим аминированием хлорпроизводных. Особенностью синтеза диаминоазинов таким методом является необходимость защиты уже имеющейся аминогруппы, например, ацильным фрагментом.

Нами было использовано несколько ацильных защитных групп, с помощью соответствующих ангидридов или кислот, из которых наиболее удобной оказалась трифторацетильная защита, обеспечивающая хорошую растворимость в органических рас-

творителях соответствующего трифторацетильного производного.

В качестве модельного соединения для хлордезоксигенирования нами было использовано соединение 3а. Использование фосфорилхлорида и тионилхлорида в присутствии третичных аминов или ДМФА не дали удовлетворительного результата. Эффективным оказалось использование в качестве третичного амина пиридина. Полученное хлорпроизводное (4) сразу по выделении обработали бутиламино с целью получения 7-аминотриазолопиримидина (5). Однако данные спектроскопии и элементного анализа показали образование триазолопурина (6).





Таким образом, нами показано, что использование 6-аминотриазолопиримидинов (2) является перспективным путем синтеза азоло[5,1-*b*]пуринов.

Работа была выполнена при поддержке гранта РФФИ 13-03-00867