ՀԱՅԿԱԿԱՆ ՔԻՄԻԱԿԱՆ ԱՄՍԱԳԻՐ
АРМЯНСКИЙ ХИМИЧЕСКИЙ ЖУРНАЛ
XXIV, № 2, 1971

УДК 542.91+547.853.3

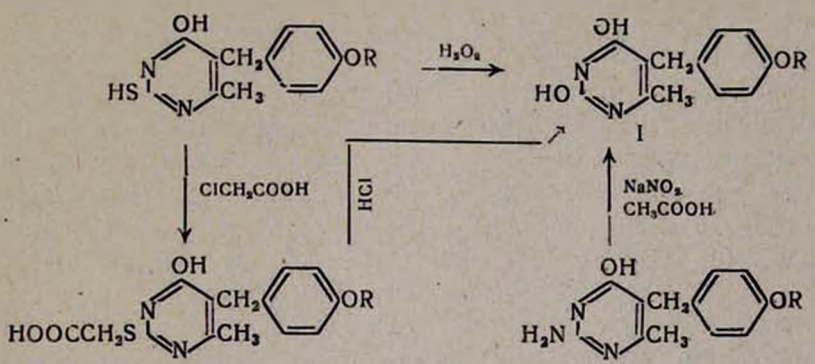
ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРИМИДИНА

XXII. СИНТЕЗ 5-(*n*-АЛКОКСИБЕНЗИЛ)-4-МЕТИЛУРАЦИЛОВ И НЕКОТОРЫЕ ИХ РЕАКЦИИ

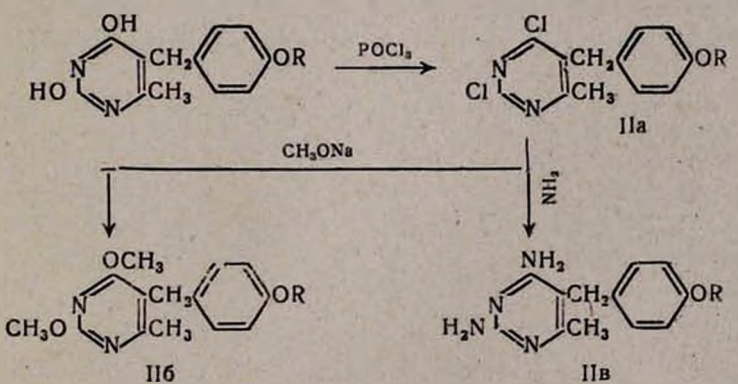
М. С. КРАМЕР, Н. Г. КАРАПЕТЯН и А. А. АРОЯН

Институт тонкой органической химии АН Армянской ССР (Ереван)

С целью изыскания соединений, стимулирующих процессы регенерации и обладающих противоопухолевыми свойствами, синтезированы аналоги метацила—5-(*n*-алкоксибензил)-4-метилурацилы по следующей схеме:



Синтез 2,6-дихлор-, диметокси-, диамино-4-метил-5-(*n*-алкоксибензил)пиримидинов осуществлен следующим образом:



А. К смеси 0,02 моля 2-меркаптопиримидина и раствора 3,2 *г* (0,08 моля) едкого натра в 20 *мл* воды осторожно прибавляют 10 *мл* 30%-ной H_2O_2 в 8 *мл* H_2O и нагревают на водяной бане 5—10 минут. Охлажден-

ный раствор подкисляют концентрированной HCl и фильтруют кристаллы I. Приведены R, выход в %; т. пл. в °С: CH_3, 95,2, 243—244; C_2H_5, 94,4, 239—240; C_3H_7, 92,8, 248—249; *изо*-C_3H_7, 92,5, 240—242; C_4H_9, 93,7, 217—218; *изо*-C_4H_9, 91,9, 213—215.

Б. 0,05 моля меркаптопиримидина и 5 *г* (0,05 моля) хлоруксусной кислоты кипятят в 75 *мл* воды и 25 *мл* уксусной кислоты до полного растворения. Раствор выпаривают в вакууме, а остаток—2-карбоксиметилмеркаптопиримидин кипятят с 40—45 *мл* концентрированной HCl, охлаждают и фильтруют кристаллы I.

В. К перемешиваемому раствору 0,01 моля 2-аминопиримидина в 25 *мл* уксусной кислоты добавляет 1,03 *г* (0,015 моля) нитрита натрия и нагревают 2—3 часа. На следующий день выпадают кристаллы I.

Смесь 0,02 моля I и 0,2 моля хлорокиси фосфора нагревают при 120—130° 4—5 часов. После удаления избытка хлорокиси фосфора остаток выливают на лед и экстрагируют эфиром. Эфир удаляют, выпадают кристаллы IIа. Приведены R; выход в %; т. кип. в °С/1 *мм;* т. пл. в °С: CH_3, 74,2,—, 78—80; C_2H_5, 72,8,—, 63—64; C_3H_7, 73,2, 205—207, 58—60; *изо*-C_3H_7, 74,5, 226—228, 55—56; C_4H_9, 71,9, 215—216, 43—44; *изо*-C_4H_9, 73,8, 195—197.

К раствору метилата натрия (0,016 *г-ат* натрия и 30 *мл* абсолютного метанола) добавляют 0,004 моля IIа и нагревают на водяной бане 3—4 часа. Остаток хлористого натрия отфильтровывают, растворитель отгоняют и остаток экстрагируют эфиром. После удаления эфира IIб перегоняют в вакууме. Приведены R; выход в %; т. кип. в °С/1 *мм:* CH_3, 76,3, 208—210; C_2H_5, 60,0, 217—220; C_3H_7, 58,5, 228—229; *изо*-C_3H_7, 53,6, 235—236; C_4H_9, 62,5, 240—242; *изо*-C_4H_9, 50,8, 250—251.

0,03 моля IIа нагревают с этанольным раствором аммиака в автоклаве при 250° 5—6 часов Отгоняют этанол, остаток растворяют в 30 *мл* 10%-ного раствора едкого натра и экстрагируют эфиром. После отгона эфира IIв закристаллизовывается. Приведены R; выход в %; т. пл. в °С: CH_3, 40,0, 102—103; C_2H_5, 47,8, 118—120; C_3H_7, 55,2, 128—130; *изо*-C_3H_7, 48,5, 56—57; C_4H_9, 42,3. 54—55; *изо*-C_4H_9, 56,4, 115—116.

Полный текст статьи депонирован
в ВИНИТИ
Регистрационный номер—2510—71 Деп.
18 января 1971 г.

Поступило 15 VII 1970