

N-(1,2,4-ТРИАЗОЛИЛ-4)АМИДИНЫ 4-АЛКОКСИ(3-ХЛОР)-  
 -ФЕНИЛУКСУСНЫХ КИСЛОТ

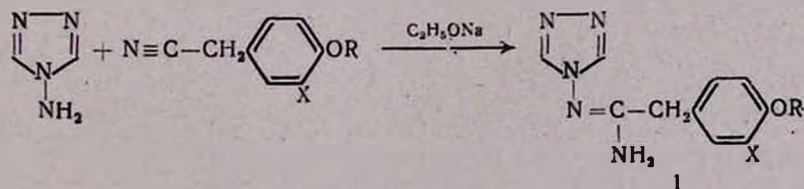
А. А. АРОЯН и М. А. ИРАДЯН

Институт тонкой органической химии им. А. Л. Мвдjoyана  
 АН Армянской ССР, Ереван

Поступило 16 VII 1973

Взаимодействие нитрилов со спиртами в кислой среде используется для синтеза амидинов. При этом первоначальным продуктом является гидрохлорид иминоэфира, обработка которого аммиаком или аминами приводит к гидрохлориду амидина. Определенный интерес представляет прямой синтез амидинов из нитрилов и аминов, который проводят в присутствии апротонных кислот [1], металлического натрия [2], амида натрия [3]. Этот метод является удобным для получения N-замещенных амидинов, содержащих ароматические и гетероциклические радикалы. В зависимости от природы нуклеофильного агента амидины могут быть получены в виде гидрохлоридов или же свободных оснований [4].

Нами исследовано взаимодействие аминотриазола с нитрилами 4-алкокси(3-хлор)фенилуксусных кислот. Реакция проведена в присутствии алкоголята натрия. Показано, что при этом получают N-(1,2,4-триазолил-4)амидины уксусных кислот.



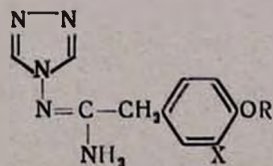
R=CH<sub>3</sub>... *изо*-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>, X=H, Cl

Использование алкоголята калия вместо алкоголята натрия не влияет на выход N-триазолилзамещенных амидинов I.

Структура соединений I предопределяется способом получения; данные элементного анализа соответствуют приведенной формуле. В масс-спектре I (R=CH<sub>3</sub>, X=H) имеется пик с m/e 231, соответствующий молекулярному иону приведенной формулы.

Амидины I представляют собой белые кристаллические вещества, растворимые в метаноле и не растворимые в других органических растворителях. Действием на I метанольным раствором хлористого водорода-

Таблица



R	X	Выход, %	Т. пл., °С	Молекулярная формула	R <sub>1</sub> *	А н а л и з, %						Дигидрохлорид		
						най д е н о			в ы ч и с л е н о			Т. пл., °С**	Cl, %	
						С	Н	Н	С	Н	Н		най д е н о	в ы ч и с л е н о
CH <sub>3</sub>	H	41,5	201—202	C <sub>11</sub> H <sub>13</sub> N <sub>3</sub> O	0,62	57,45	5,36	30,60	57,13	5,66	30,28	207—208	23,07	23,31
C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	43,8	182—183	C <sub>13</sub> H <sub>15</sub> N <sub>3</sub> H	0,68	58,45	6,30	28,89	58,76	6,16	28,55	193—194	22,26	22,28
C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	40,3	178—179	C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O	0,70	60,53	6,68	26,91	60,21	6,61	27,01	200—201	20,80	21,34
<i>изо</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	37,1	187—188	C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O	0,72	59,97	6,71	26,70	60,21	6,61	27,01	199—200	21,42	21,34
C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	41,2	170—171	C <sub>14</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O	0,74	61,29	7,10	25,31	61,51	7,00	25,62	202—203	20,27	20,48
<i>изо</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	36,0	185—186	C <sub>14</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O	0,75	61,05	7,31	25,61	61,51	7,00	25,62	196—197	20,12	20,48
ClH <sub>3</sub>	Cl	45,8	214—215	C <sub>11</sub> H <sub>13</sub> ClN <sub>3</sub> O	0,50	49,44	4,28	26,10	49,72	4,52	26,36	203—204	20,65	20,94

\* ТСХ на окиси алюминия II степени активности в системе этилацетат — метанол, 5:1.

\*\* С разложением.

да получены гидрохлориды. Анализ солей показывает, что они являются дигидрохлоридами.

### Экспериментальная часть

*N*-(1,2,4-Триазолил-4)амидины 4-алкоксифенил- и 4-метокси-3-хлор-фенилуксусных кислот (I). К алкоголяту натрия, полученному из 2,3 г (0,1 г-ат) натрия и 50 мл абс. этанола, при перемешивании добавляют 8,4 г (0,1 моля) 4-амино-1,2,4-триазола [5]. После его растворения прикапывают 0,1 моля 4-алкокси(3-хлор)бензилцианида [6,7]. Смесь нагревают на водяной бане 4—5 час, затем добавляют 8—10 мл воды и перемешивают 10—15 мин, оставляют на ночь, выпавший осадок отфильтровывают. Из маточного раствора при охлаждении в холодильнике выпадает еще некоторое количество вещества. Продукт перекристаллизовывают из 50% смеси бензола и этанола (табл.).

### Л И Т Е Р А Т У Р А

1. P. Oxley, M. W. Patridge, W. F. Short, J. Chem. Soc., 1947, 1110.
2. F. C. Cooper, M. W. Patridge, J. Chem. Soc., 1953, 255.
3. J. A. Gautier, M. Mlocque, C. Fauran, A. Ye. Le Cloarec, Bull. Soc. chim. France, 1969, 791; 1970, 200.
4. H. G. O. Becker, L. Krahnert, G. Rasch, W. Riedlger, J. Witthauer, J. prakt. Chem., 311, 477 (1969).
5. А. Н. Кост, Ф. Генц, ЖОХ, 28, 2773 (1958).
6. А. Л. Мнджоян, А. А. Ароян, Т. Р. Овсепян, Изв. АН Арм. ССР, ХН, 14, 157 (1961).
7. А. А. Ароян, П. Р. Акопян, Т. Р. Овсепян, Арм. хим. ж., 24, 828 (1971).