

Краткие сообщения**СИНТЕЗ И ОСОБЕННОСТИ АМИНИРОВАНИЯ 1-(ДИФЕНИЛМЕТИЛ)-5-БРОМУРАЦИЛА**

Новиков М.С., Тимофеева К.В., Солодунова Г.Н., Озеров А.А.

Волгоградский государственный медицинский университет, кафедра фармацевтической и токсикологической химии

Подробная информация об авторах размещена на сайте
«Учёные России» - <http://www.famous-scientists.ru>

С целью поиска новых биологически активных соединений нами в условиях силильного варианта реакции Гилберта-Джонсона был осуществлен синтез 1-(дифенилметил)-5-бром урацила (**1**). Кипячение эквимольных количеств 2,4-бис(триметилсилилокси)-5-бромпиридина с дифенилбромметаном привел к соединению **1**, выход которого составил 46 %. Последующее аминирование производного 5-бром урацила **1** морфолином, анилином или бензиламином при кипячении в растворе этиленгликоля неожиданно привело к отщеплению дифенилметильного заместителя и образованию соответствующих 5-морфолино- (**2**), 5-фениламино- (**3**) или 5-бензиламиноурацилов (**4**), выход которых составил 52-63 % (схема 1).

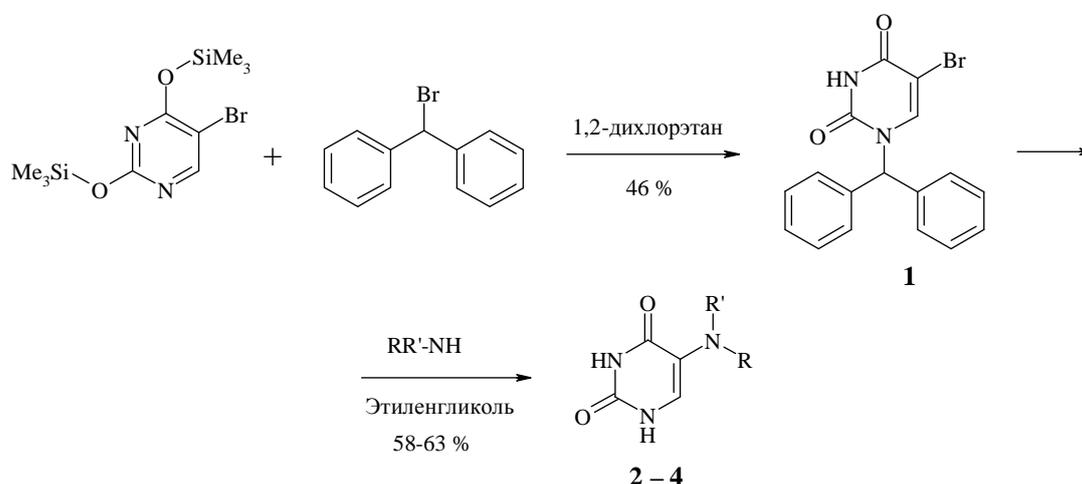


Схема 1. R = C₆H₅, CH₂C₆H₅; R' = H; R + R' = (CH₂CH₂)₂O

Строение полученных соединений **1** – **4** определялась ПМР-спектроскопией и масс-спектрометрией.

СИНТЕЗ 1-БЕНЗИЛ-5-(ФЕНИЛАМИНО)ПРОИЗВОДНЫХ УРАЦИЛА

Новиков М.С., Тимофеева К.В., Солодунова Г.Н., Озеров А.А.

Волгоградский государственный медицинский университет, кафедра фармацевтической и токсикологической химии

Подробная информация об авторах размещена на сайте
«Учёные России» - <http://www.famous-scientists.ru>

С целью поиска новых биологически активных соединений нами в условиях силильного варианта реакции Гилберта-Джонсона был осуществлен синтез 1-бензил-5-(фениламино)производных урацила. Кипячение 2,4-бис(триметилсилилокси)-5-(фениламино)производного пиридина **1** с 10 – 20 %-ным мольным избытком бензилбромидом **2** в растворе 1,2-дихлорэтана привело к соответствующим 1-бензилированным производным 5-(фениламино)урацила **3**, выход которых был достаточно высоким и составил 55-66 % (схема 1). Следует отметить высокую региоселективность реакции: отсутствие образования продуктов N³-моно- и N¹,N³-диалкилирования.

Структура синтезированных 1-бензил-5-(фениламино)производных урацила **3** подтверждена ПМР-спектроскопией и масс-спектрометрией, чистота и индивидуальность веществ доказаны методом тонкослойной хроматографии, состав – элементным анализом.

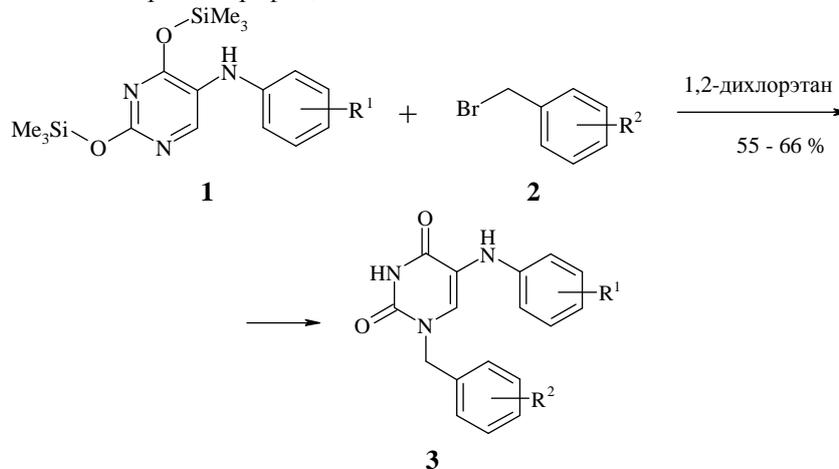


Схема 1. $R^1 = \text{H}, 4\text{-Me}, 4\text{-MeO}, 4\text{-Cl}$; $R^2 = 3\text{-Cl}, 2,4\text{-Cl}_2$

СИНТЕЗ 1-БЕНЗИЛ-5-(БЕНЗИЛ- И ФЕНЕТИЛАМИНО)УРАЦИЛОВ

Тимофеева К.В., Новиков М.С., Озеров А.А.

Волгоградский государственный медицинский университет, кафедра фармацевтической и токсикологической химии

Подробная информация об авторах размещена на сайте

«Учёные России» - <http://www.famous-scientists.ru>

С целью поиска новых биологически активных был осуществлен синтез 1-бензил-5-(бензил- и фенетиламино)производных урацила, который заключался в обработке 1-бензил-5-бромурацилов (**1**) 5-кратным мольным избытком бензиламина или фенетиламина при температуре кипения этиленгликоля, использованного в качестве растворителя. В результате реакции были получены 1-бензил-5-(бензиламино)- (**2**) и 1-бензил-5-(фенетиламино)производные урацила (**3**) с выходами 63-80% и 69-85%, соответственно (схема 1).

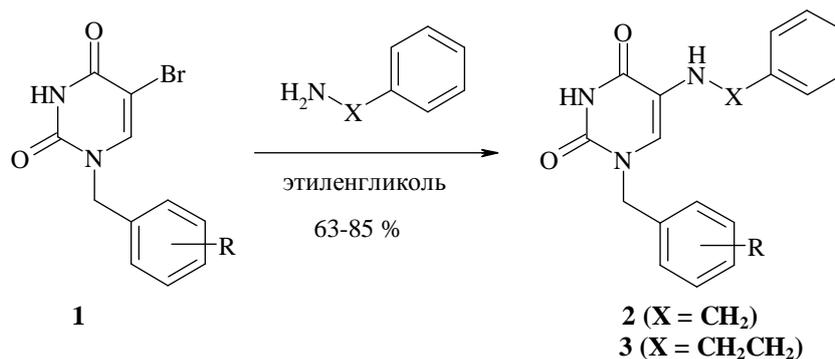


Схема 1. $R = 4\text{-CH}_3, 3,5\text{-(CH}_3)_2, 3\text{-Cl}, 2,4\text{-Cl}_2$

Нами обнаружено, что 1-бензил-5-бромурацилы (**1**) не взаимодействуют с анилинами, обладающими низкой нуклеофильностью, но аминируются бензиламином или фенетиламином – первичными аминами с более высокой нуклеофильностью.

Структура синтезированных 1-бензил-5-(бензиламино)- (**2**) и 1-бензил-5-(фенетиламино)производные урацила (**3**) подтверждена ПМР-спектроскопией и масс-спектрометрией, чистота и индивидуальность веществ доказаны методом тонкослойной хроматографии, состав – элементным анализом.