

## РЕАКЦИОННАЯ СПОСОБНОСТЬ ФУНКЦИОНАЛЬНОЗАМЕЩЕННЫХ 1,2,4-ТРИАЗИНОВ

А.И.Акиншин, Л.М.Миронович

Синтез и исследование реакционной способности замещенных 1,2,4-триазинов является актуальным, вследствие биологической активности, проявляемой соединениями данного класса гетероциклов, в качестве пестицидов и фармакологических препаратов. Особый интерес представляют amino-, гидразино производные 1,2,4-триазинов, которые являются реакционноспособными агентами для получения новых производных по amino-, гидразиновой группе, а также бициклических систем.

Нами осуществлен синтез 3-гидразино-5-оксо-6-R-2H-1,2,4-триазинов (I) гидразинолизом 5-оксо-3-тиоксо-6-R-2H,4H-1,2,4-триазинов в среде пропанола-2 при температуре 70-80° С. Формилирование муравьиной кислотой соединения I, через промежуточное 3-формилгидразинопроизводное 1,2,4-триазина, которое из реакционной смеси не выделялось, приводит к образованию бициклической системы — 2-оксо-3-R-1H-1,2,4-триазоло[4,5-b]1,2,4-триазина (II). Замыкание нового цикла проходит по атому N<sub>(2)</sub> триазинового кольца, а не атома азота в положении 4 гетероцикла, вследствие большей нуклеофильности, согласно литературных данных, атома азота в положении 2 гетероцикла.

Исследовано формилирование муравьиной кислотой 4-амино-3-метилмеркато-5-оксо-6-*трет*-бутил-2H-1,2,4-триазина (III). Соединение (III) получено конденсацией калиевой соли триметилпировиноградной кислоты с тиокарбгидразидом в щелочной среде при кипячении с последующим метилированием иодистым метилом продукта конденсации в 1 N водном метанольном растворе едкого натра (соотношение метанол : вода, 1:1) при температуре 25° С. Продукт метилирования выпадает в осадок по мере прохождения реакции.

Кипячение соединения III с избытком муравьиной кислоты в отсутствие растворителя приводит к одновременному моноформилированию amino- группы и гидразиновой группы 1,2,4-триазинового цикла. Вследствие высокой реакционной способности полученного продукта формилирования, за счет внутримолекулярной атаки нуклеофила, в качестве которого выступает атом азота в положении 2 триазинового кольца, электрофильного центра формилгидразинопроизводного 1,2,4-триазина происходит замыкание нового цикла с элиминированием воды и образованием 2-оксо-1-формиламино-3-*трет*-бутил-1,2,4-триазоло[4,5-b]1,2,4-триазина (IV).

Строение синтезированных соединений установлено по совокупности данных элементного анализа, ИК- и ЯМР <sup>1</sup>H- спектроскопии.