

Acta Universitatis Palackianae Olomucensis. Facultas Rerum
Naturalium. Mathematica-Physica-Chemica

P. Peč; Jan Slouka; Karel Nálepa

5-substituierte-6-azauracile II. Die Synthese von 5-(2',3'-Dimethoxystyryl) und
5-(2',3'- Dimethoxybenzyl)-6-azauracile

Acta Universitatis Palackianae Olomucensis. Facultas Rerum Naturalium. Mathematica-Physica-Chemica, Vol.
11 (1971), No. 1, 401--409

Persistent URL: <http://dml.cz/dmlcz/119959>

Terms of use:

© Palacký University Olomouc, Faculty of Science, 1971

Institute of Mathematics of the Academy of Sciences of the Czech Republic provides access to digitized documents strictly for personal use. Each copy of any part of this document must contain these *Terms of use*.



This paper has been digitized, optimized for electronic delivery and stamped with digital signature within the project *DML-CZ: The Czech Digital Mathematics Library* <http://project.dml.cz>

**5-SUBSTITUIERTE-6-AZUARACILE II.
DIE SYNTHESE VON 5-(2',3'-DIMETHOXYSTYRYL)
UND 5-(2',3'-DIMETHOXYBENZYL)-6-AZUARACILE**

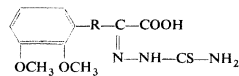
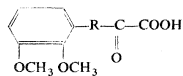
PAVEL PEČ, JAN SLOUKA UND KAREL NÁLEPA

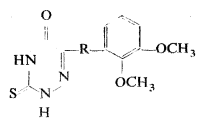
(Eingelangt am 3. 7. 1969)

In der vorhergegangenen Mitteilung¹ haben wir die Vorbereitung von p-Chlorstyryl — sowie p-Chlorbenzyl-6-azauracil beschrieben. In der vorliegenden Arbeit wird über analoge Herstellung von 2,3-Dimethoxystyryl und 2,3-Dimethoxybenzyl-derivate berichtet.

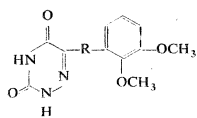
Durch eine Kondensation von 2,3-Dimethoxybenzaldehyd mit Brenztraubensäure wurde 2,3-Dimethoxybenzylidenbrenztraubensäure gewonnen (Ia). Die Reaktion wurde durch Kochen im wässrig-methanolischen Medium unter katalytischer Einwirkung von Natriumcarbonat durchgeführt; mit Rücksicht auf eine kleine Reaktivität des 2,3-Dimethoxybenzaldehyds lag die Ausbeute nur 5% umher. Die Säure Ia wurde durch Reaktion mit Thiosemicarbazid im wässrigen Medium in das Thiosemicarbon (IIa) überführt, das durch alkalische Zyklisierung glatt in guter Ausbeute in das 2-Thio-5-(2',3'-dimethoxystyryl)-6-azauracil (IIIa) überging. Die Oxydation mit Kaliumpermanganat führt es in guter Ausbeute zu dem 5-(2',3'-Dimethoxystyryl)-6-azauracil (IVa) über.

Zur Synthese von 2-Thio-5-(2',3'-dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IIIb) wurde eine vereinfachte Methode verwendet², die aus einem leichtherstellbaren Azlaktone auszugehen erlaubt. Durch alkalische Spaltung von 2-Phenyl-4-(2',3'-dimethoxybenzyliden)-oxazolone^{5,3} und durch folgende Reaktion mit Thiosemikarbazid wurde nach dem Ansäuern des Reaktionsgemisches in der Ausbeute von 87% das Triazin IIIb gewonnen. Die Umwandlung dieser Verbindung in das 5-(2',3'-Dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IVb) durch Oxydation mit Kaliumpermanganat hatte einen glatten Verlauf.





(III)



(IV)

a) R = $-\text{CH}=\text{CH}-$

b) R = $-\text{CH}_2-$

EXPERIMENTELLER TEIL

2,3-Dimethoxybenzylidenbrenztraubensäure (Ia)

Zu einem Gemisch von 16,6 g (0,1M) 2,3-Dimethoxybenzaldehyd, 8,8 g (0,1M) Brenztraubensäure und 120 ml Methanol wurde eine Lösung von 11 g Na_2CO_3 in 120 ml Wasser zugegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 4 Std unter Rückfluss gekocht und nach Abkühlen zur Entfernung des unabreagierten 2,3-Dimethoxybenzaldehyds mit Äther extrahiert. Die wassermethanolische Lösung wurde auf kleines Volumen eingengt, mit 100 ml Wasser verdünnt und mit 6 N HCl bis pH 1 angesäuert. Der ausgeschiedene kristalline orangefarbige Niederschlag wurde abgesaugt und mit Wasser durchgewaschen. Die Ausbeute nach dem Austrocknen im Exsikkator mit P_2O_5 beträgt 1,3 g (6%). Nach Umkristallisation aus Wasser wurden hellorangefarbene Kriställchen gewonnen. Schmp. $138-40^\circ\text{C}$. Die Probe wurde über P_2O_5 zur Analyse getrocknet.

Für $\text{C}_{12}\text{H}_{12}\text{O}_5$ (236,22) Ber.: 61,01 % C, 5,12 % H
Gef.: 61,16 % C, 5,19 % H

2,3-Dimethoxybenzylidenbrenztraubensäurethiosemikarbazon (IIa)

Zu einer Lösung von 590 mg (2,5 mM) der 2,3-Dimethoxybenzylidenbrenztraubensäure in 80 ml von heissem Wasser wurde 230 mg (2,5 mM) Thiosemikarbazid gegeben und das Reaktionsgemisch wurde kurz gekocht. Nach Abkühlung wurden hellgelbe Kriställchen abgesaugt. Ausbeute beträgt 600 mg (79%). Nach Umkristallisation aus Wasser Schmp. $189-90^\circ\text{C}$.

Für $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_3\text{O}_4\text{S}$ (309,27) Ber.: 50,48 % C, 4,89 % H, 13,59 % N
Gef.: 50,32 % C, 4,61 % H, 13,70 % N

2-Thio-5-(2',3'-dimethoxystyryl)-6-azauracil (IIIa)

Das Gemisch von 300 mg (1 mM) Thiosemikarbazon (IIa), 200 mg Na_2CO_3 und 15 ml Wasser wurde 3 Stdn auf kochendem Wasserbad erwärmt. Nach Zugabe von Aktivkohle wurde das Reaktionsgemisch filtriert und mit 6 N HCl bis pH 1 angesäuert. Der ausgeschiedene kristalline Niederschlag wurde nach dem Abkühlen

abgesaugt und mit kleiner Menge von Wasser durchgewaschen. Ausbeute beträgt 200 mg (64 %). Nach Umkristallisation aus Wasser wurden hellgelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 266–8 °C.

Für $C_{13}H_{13}N_3O_3S(291,26)$ Ber.: 53,61 % C, 4,50 % H, 14,43 % N
Gef.: 53,29 % C, 4,32 % H, 14,31 % N

2-Thio-5-(2',3'-dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IIIb)

Das Gemisch von 4,7 g (15 mM) 2-Phenyl-4-(2',3'-dimethoxybenzyliden)-oxazolone³, 10,5 g KOH und 310 ml Wasser wurde 6 Stdn unter Rückfluss gekocht. Dann wurde 1,37 g (15 mM) Thiosemikarbazid zugesetzt und das Reaktionsgemisch wurde weitere 4 Stdn gekocht. Nach Zugabe von Aktivkohle wurde das Reaktionsgemisch filtriert und mit CH_3COOH bis pH 4–3 angesäuert. Nach Abkühlung wurde der kristalline Stoff abgesaugt und mit Wasser durchgewaschen. Ausbeute beträgt 3,46 g (87 %). Nach Umkristallisation aus Wasser wurden farblose Kriställchen gewonnen. Schmp. 177 °C.

Für $C_{12}H_{13}N_3O_3S(279,25)$ Ber.: 51,61 % C, 4,69 % H, 15,05 % N
Gef.: 51,65 % C, 4,96 % H, 14,93 % N

5-(2',3'-Dimethoxystyryl)-6-azauracil (IVa)

Zu einer Suspension von 145 mg (0,5 mM) des Triazins (IIIa) in 25 ml Wasser wurde tropfenweise die 5%-ige Lösung von KOH bis zur Bildung einer Lösung zugesetzt. Hierzu wurde dann langsam unter ständigem Rühren eine Lösung von 160 mg (1 mM) $KMnO_4$ in 8 ml H_2O zugesetzt. Nach Abkühlung wurde das Gemisch abfiltriert und MnO_2 am Filter mehrmals mit heissem Wasser durchgewaschen. Die vereinigten Filtrate wurden auf 60 °C erwärmt und mit konz. HCl bis pH 0 angesäuert. Nach Abkühlung wurde der ausgeschiedene kristalline Stoff abgesaugt und mit Wasser durchgewaschen. Ausbeute beträgt 120 mg (86 %). Nach Umkristallisation aus Wasser wurden hellgelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 269–70 °C.

Für $C_{13}H_{13}N_3O_4(275,26)$ Ber.: 56,72 % C, 4,76 % H, 15,26 % N
Gef.: 56,66 % C, 4,71 % H, 15,32 % N

5-(2',3'-Dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IVb)

Der Stoff wurde in gleicher Weise aus 1,95 g (7 mM) Triazin (IIIb), und 2,22 g (14 mM) $KMnO_4$ in der Ausbeute 1,46 g (81,8 %) dargestellt. Nach Umkristallisation aus Wasser wurden farblose Kriställchen gewonnen. Schmp. 170–1 °C.

Für $C_{12}H_{13}N_3O_4(263,25)$ Ber.: 54,75 % C, 4,98 % H, 15,96 % N
Gef.: 54,77 % C, 4,03 % H, 15,80 % N

LITERATUR

- [1] *Slouka J., Nálepa K.*: Acta Univ. Palackianae Olomouensis Fac. Rerum Nat. **12** 145 (1963).
[2] *Slouka J., Nálepa K.*: J. prakt. Chem. [4] **18** 188 (1962).
[3] *Späth E., Mossetig E.*: Liebigs Ann. **433** 138 (1923).

Summary

5-SUBSTITUTED-6-AZURACILES II SYNTHESIS OF 5-(2',3'-DIMETHOXYSTYRYL)- AND 5-(2',3'-DIMETHOXYBENZYL)-6-AZURACILES

PAVEL PEČ, JAN SLOUKA AND KAREL NÁLEPA

By condensation of 2,3-dimethoxybenzaldehyde with pyruvic acid, was obtained 2,3-dimethoxybenzylidenpyruvic acid (Ia), which was transformed to its thiosemicarbazone (IIa). This compound was cyclized at 2-thio-5-(2',3'-dimethoxystyryl)-6-azauracil (IIIa).

2-Thio-5-(2',3'-dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IIIb) was obtained in a simple way directly from 2-phenyl-4-(2',3'-dimethoxybenzyliden)-oxazolone (5).

Triazines (IIIa) and (IIIb) were transformed at corresponding 5-substituted-6-azauraciles (IVa) and (IVb) by oxydation with KMnO_4 .

Shrnutí

5-SUBSTITUOVANÉ 6-AZURACILY II

PAVEL PEČ, JAN SLOUKA A KAREL NÁLEPA

Kondensací 2,3-dimethoxybenzaldehydu s kyselinou pyrohroznovou byla připravena kyselina 2,3-dimethoxybenzylidenpyrohroznová (Ia), která byla převedena na thiosemikarbazon (IIa). Cyklisací této látky byl získán 2-thio-5-(2',3'-dimethoxystyryl)-6-azauracil (IIIa).

2-Thio-5-(2',3'-dimethoxybenzyl)-6-azauracil (IIIb) byl připraven jednoduším způsobem přímo z 2-fenyl-4-(2',3'-dimethoxybenzyliden)-oxazolonu (5).

Oxydaci KMnO_4 byly triaziny (IIIa) i (IIIb) převedeny na odpovídající 5-substituované 6-azauracily (IVa) a (IVb).

5-SUBSTITUIERTE-6-AZAUACILE III. DIE SYNTHESE VON EINIGEN WEITEREN UNGESÄTTIGTEN DERIVATEN

JAN SLOUKA, KAREL NÁLEPA UND PAVEL PEČ
(Eingelangt am 3. 7. 1969)

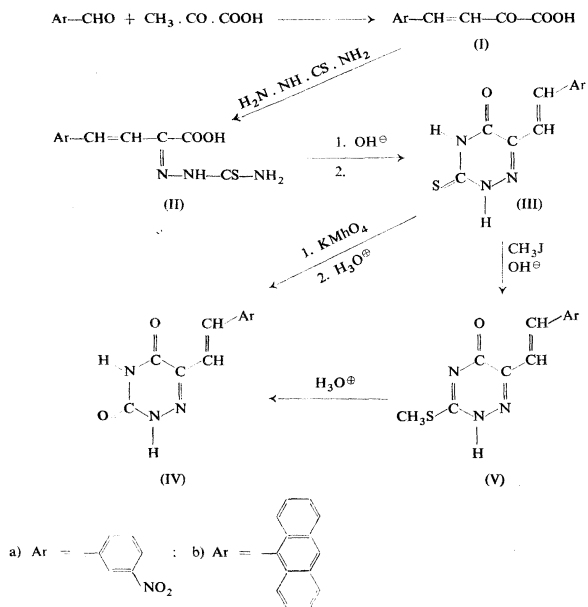
Mit den Synthesen von 6-Azaauracilen substituierten in der Lage 5 durch einen ungesättigten Rest hat sich eine ganze Reihe von Autoren beschäftigt. Zuerst war es Bougault¹, der das 5-Styryl-6-azauracil vorbereitete; mit den weiteren Synthesen in diesem Gebiet beschäftigten sich Bodfors², Semonský mit seinen Mitarbeitern³, ferner Saikawa und Maeda⁴. Wir haben uns auch in vorhergegangenen Mitteilungen^{5,6,7,8} mit die Synthesen von einigen 5-Substituierten-6-azauracilen dieses Typus beschäftigt. In der vorliegenden Arbeit knüpfen wir auf die erwähnten vorhergegangenen Mitteilungen an.

Durch Kondensation von m-Nitrobenzaldehyd, bzw. 9-Anthraldehyd mit Brenztraubensäure wurden die entsprechenden ungesättigten α -Ketokarbonsäuren (Ia) und (Ib) hergestellt. Die Säure Ia wurde durch eine Reaktion der entsprechenden Komponenten im methanolischen Medium unter katalytischer Wirkung von Natriumkarbonat dargestellt, nach Stecker, Waldmann und Foling⁹, für die Vorbereitung der Säure Ib hat sich als Reaktionsmedium am besten ein Gemisch von Pyridin-Methanol unter katalytischer Wirkung von Natriumhydroxid bewährt. Durch Reaktion mit Thiosemikarbazid wurden die Säuren Ia und Ib in die entsprechenden Thiosemikarbazone (IIa) und (IIb) überführt, durch deren alkalische Zyklisierung in guter Ausbeute die entsprechenden 5-Substituierte-2-thio-6-azauracile (IIIa) und (IIIb) gewonnen wurden. Diese Verbindungen wurden in die entsprechenden 6-Azaauracile (IVa) und (IVb) durch Oxydation mit Kaliumpermanganat überführt; das 5-(m-Nitrobenzyliden)-6-azauracil (IVa) wurde ferner auch durch die saure Hydrolyse des 2-Methylthioderivats (Va), das durch Methylierung des Triazins IIIa mit Methyljodid zubereitet wurde, gewonnen.

EXPERIMENTELLER TEIL

2-OXO-4-(9'-ANTHRYL)-3-BUTENSÄURE (Ib)

Zu einer Lösung von 1,03 g (5 mMol) 9-Anthraldehyd und 600 mg (6,8 mMol) Brenztraubensäure im Gemisch von 15 ml Pyridin und 5 ml Methanol wurde allmählich eine 30%-ige wässrige Lösung von NaOH bis pH 10 zugesetzt. Das Reaktions-



gemischt wurde dann intensiv 8 Stunden bei Zimmertemperatur gerührt. Der orangefarbene Niederschlag des Natriumsalzes wurde dann abgesaugt, mit Pyridin durchgewaschen und in 300 ml warmem (50 °C) Wasser aufgelöst. Die Lösung wurde nach der Zugabe von kleiner Menge Aktivkohle filtriert und mit konzentrierter Chlorwasserstoffsäure bis pH 1 angesäuert. Der ausgeschiedene orangefarbene Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser durchgewaschen und ausgetrocknet. Die Ausbeute beträgt 1,05 g (77,8 %). Nach Umkristallisation aus Äthanol-Wasser oder noch besser nach der Auflösung in einer verdünnten Lösung von Natriumkarbonat, durch Filtrierung der Lösung und nach Ansäuern mit konz. HCl, wurde die Säure Ib in Form von violetten Kriställchen gewonnen. Schmp. 170–2 °C (Zers.).

Für $\text{C}_{18}\text{H}_{12}\text{O}_5$ (276,28) Ber.: C 78,25 %, H 4,38 %
 Gef.: C 78,51 %, H 4,49 %

m-NITROBENZYLIDENBRENZTRAUBENSÄURETHIOSEMIKARBAZON (IIa)

Zur Lösung von 1,4 g (6,3 mMol) der m-Nitrobenzylidenbrenztraubensäure⁹ in 300 ml heissem Wasser wurden 580 mg (6,3 mMol) Thiosemikarbazid zugesetzt. Das Reaktionsgemisch wurde dann kurz gekocht und abgekühlt. Der ausgeschiedene gelbe kristalline Stoff wurde abgesaugt, mit Wasser und Äthanol nachgewaschen. Die Ausbeute beträgt 1,6 g (86 %). Nach dreimaliger Umkristallisation aus Äthanol-Wasser wurden hellgelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 205–207 °C. Der Stoff wurde 2 Stunden bei 100 °C zur Analyse getrocknet.

Für C₁₁H₁₀N₄O₄S(294,22) Ber.: C 44,90 %, H 3,43 %, N 19,04 %
Gef.: C 44,72 %, H 3,63 %, N 19,25 %

2-OXO-4-(9'-ANTHRYL)-3-BUTENSÄURETHIOSEMIKARBAZON (IIb)

Der Stoff wurde analog aus 550 mg (2 mMol) der Säure Ib, die im heissen Gemisch von 90 ml Wasser, 30 ml Eisessigsäure und 90 ml Äthanol aufgelöst wurde und aus 185 mg (2 mMol) Thiosemikarbazid in der Ausbeute 700 mg (100 %) hergestellt. Nach Umkristallisation aus Äthanol bildet orangefarbige Kriställchen. Schmp. 201–203 °C.

Für C₁₉H₁₅N₃O₂S(349,33) Ber.: C 65,32 %, H 4,33 %, N 12,03 %
Gef.: C 65,09 %, H 4,39 %, N 11,75 %

2-THIO-5-(m-NITROSTYRYL)-6-AZAUACIL (IIIa)

Zur Suspension von 1,5 g (5 mMol) des Thiosemikarbazons IIa in 100 ml Wasser wurde 1,1 g Na₂CO₃ zugesetzt und die entstandene Lösung wurde 5 Stunden am kochenden Wasserbad erhitzt. Nach Zugabe von kleiner Menge Aktivkohle wurde die Lösung filtriert und mit konz. HCl bis pH 4 angesäuert. Nach Abkühlung wurde der gelbe kristalline Stoff abgesaugt, mit Wasser durchgewaschen und ausgetrocknet. Die Ausbeute beträgt 1,35 g (96,4 %). Nach Umkristallisation aus grosser Menge heissen Wasser wurden hellgelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 222–224 °C. Der Stoff wurde 2 Stunden bei 100 °C zur Analyse getrocknet.

Für C₁₁H₈N₄O₃S(276,21) Ber.: C 47,83 %, H 2,92 %, N 20,29 %
Gef.: C 48,09 %, H 3,18 %, N 20,06 %

2-THIO-5-[β-(9'-ANTHRYL)-VINYL]-6-AZAUACIL (IIIb)

Der Stoff wurde analog aus 350 mg (1 mMol) des Thiosemikarbazons (IIb), 60 ml Wasser und 400 mg Na₂CO₃ in der Ausbeute von 300 mg (90,5 %) hergestellt. Nach Umkristallisation aus Äthanol wurde in Form von hellgelben Kriställchen gewonnen. Schmp. 325–327 °C (Zers.).

Für C₁₉H₁₃N₃O₃S(331,32) Ber.: C 68,87 %, H 3,96 %, N 12,68 %
Gef.: C 68,59 %, H 4,05 %, N 12,73 %

3-METHYLMERCAPTO-5-OXO-6-(m-NITROSTYRYL)-2,5-DIHYDRO-1,2,4-
TRIAZIN (Va)

Zur Lösung von 1,1 g (3,98 mMol) des Triazins IIIa und 900 mg KOH in 80 ml Wasser wurde 600 mg (4,4 mMol) Methyljodid zugesetzt. Das Reaktionsgemisch wurde dann 48 Stunden bei Zimmertemperatur in einem geschlossenen Kolben bei zeitweisem Umschütteln belassen, dann abfiltriert und das Filtrat mit konz. HCl bis pH 0 angesäuert. Der ausgeschiedene kristalline Stoff wurde abgesaugt, mit Wasser durchgewaschen und ausgetrocknet. Die Ausbeute beträgt 1,05 g (91,3%). Nach Umkristallisation aus Äthanol-Wasser wurden gelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 248 – 250 °C.

Für $C_{12}H_{10}N_4O_3S(290,23)$ Ber.: C 49,66 %, H 3,47 %, N 19,31 %
Gef.: C 49,36 %, H 3,39 %, N 19,33 %

5-(m-NITROSTYRYL)-6-AZAUACIL (IVa)

a) Zur Suspension von 800 mg (2,8 mMol) des Triazins IIIa in 100 ml Wasser wurde soviel 10%-iger Lösung von KOH zugesetzt, bis zur Entstehung einer Lösung. Hierzu wurde dann teilweise und unter Rühren die Lösung von 885 mg (5,6 mMol) $KMnO_4$ in 30 ml heissen Wasser zugesetzt. Nach 30 Minuten wurde das Reaktionsgemisch abfiltriert, MnO_2 am Filter wurde mehrmals mit heissem Wasser nachgewaschen, die vereinigten Filtrate wurden auf 60 °C erwärmt und mit konz. HCl bis pH 0 angesäuert. Der ausgeschiedene kristalline Niederschlag wurde nach Abkühlung abgesaugt, mit Wasser durchgewaschen und ausgetrocknet. Die Ausbeute beträgt 400 mg (53,3%). Nach zweimaliger Umkristallisation aus grösserer Menge von Wasser wurden hellgelbe Kriställchen gewonnen. Schmp. 232 – 235 °C.

b) Ein Gemisch von 500 mg (1,72 mMol) des Triazins Va, 20 ml konz. HCl und 20 ml Äthanol wurde 5 Stunden unter Rückfluss gekocht. Nach Abkühlung wurde der ausgeschiedene kristalline Stoff abgesaugt, mit Wasser durchgewaschen und ausgetrocknet. Die Ausbeute beträgt 320 mg (72,7%). Nach zweimaliger Umkristallisation aus grösserer Menge von Wasser wurde ein hellgelber kristalliner Stoff gewonnen. Schmp. 232 – 235 °C. Misch-Schmelzpunkt mit dem auf vorangehenden Wege erhaltenen Stoff weist keine Depression auf.

Für $C_{11}H_8N_4O_4(260,21)$ Ber.: C 50,77 %, H 3,10 %, N 21,53 %
Gef.: C 50,62 %, H 3,36 %, N 21,63 %

5-[β -(9'-ANTHRYL)-VINYL]-6-AZAUACIL (IVb)

Dieser Stoff wurde analog wie bei vorangehender Verbindung aus 660 mg (2 mMol) des Triazins IIIb, 300 ml Wasser und 635 mg (4 mMol) $KMnO_4$ in der Ausbeute von 63,5 % zubereitet, und bildet nach Umkristallisation aus Äthanol gelbe Kriställchen. Schmp. 338 – 340 °C.

Für $C_{19}H_{13}N_3O_2$ (315,32) Ber.: C 72,37 %, H 4,16 %, N 13,33 %
Gef.: C 72,21 %, H 4,23 %, N 13,18 %

LITERATUR

- [1] *Bougault J.*: Compt. rend. **159** 83 (1914); Ann. Chim. (9), 317, 344 (1916).
- [2] *Bodfors S.*: Ann. **639** 125 (1961).
- [3] *Semonský M. a spol.*: Coll. Czech. Chem. Commun. **32** 4 439 (1967).
- [4] *Saikawa I., Maeda T.*: Yakugaku Zasshi **88** 369 (1968) C. A. **69** 86 970a (1968).
- [5] *Slouka J.*: J. prakt. Chem. (4) **16** 220 (1962).
- [6] *Slouka J., Nálepa K.*: Acta Univ. Palack. Ol. Fac. Rerum Nat. **12** 145 (1963).
- [7] *Slouka J., Nálepa K.*: Acta Univ. Palack. Ol. Fac. Rerum Nat. **30** 373 (1969)
- [8] *Peč P., Slouka J., Nálepa K.*: Acta Univ. Palack. Ol. Fac. Rerum Nat. **33** 401 (1971)
- [9] *Stecker E. D., Waldmann A., Foling D.*: J. Org. Chem. **30** 1800 (1965).

Summary

5-SUBSTITUTED-6-AZARACILES III

JAN SLOUKA, KAREL NÁLEPA AND PAVEL PEČ

Thiosemicarbazones (IIa) and (IIb) were prepared from *m*-nitrobenzylidenpyruvic acid and from 2-oxo-4-(9'-anthryl)-3-butenic acid (Ib). Through cyclization of these compounds the corresponding 5-substituted 2-thio-6-azauraciles (IIIa) and (IIIb) were obtained. The triazines IIIa and IIIb through oxidation with $KMnO_4$ were transformed into corresponding 5-substituted-6-azauracils (IVa) and (IVb). The triazine IVa was obtained by hydrolysis of 3-methylmercaptocompound (Va) as well.

Shrnutí

5-SUBSTITUOVANÉ 6-AZARACILY III

JAN SLOUKA, KAREL NÁLEPA A PAVEL PEČ

Kyselina *m*-nitrobenzylidenpyrohroznová a 2-oxo-4-(9'-anthryl)-3-butenová kyselina (Ib) byly převedeny na odpovídající thiosemikarbazony (IIa) a (IIb), jejichž cyklisací byly získány příslušné 5-substituované 2-thio-6-azauracily (IIIa) a (IIIb). Oxidací $KMnO_4$ byly triaziny IIIa a IIIb převedeny na odpovídající 5-substituované 6-azauracily (IVa) a (IVb). Triazin (IVb) byl připraven rovněž i kyselou hydrolysou 3-methylmerkaptoslučeniny (Va).