

[Heterocycles, 14, 407 (1980)]

**A Novel Synthesis of Pyrido [2,3-*d*] pyrimidines by Reaction of Uracils
with 6-Aminouracils *via* Pyrimidine-to-pyridine Transformation**

KOSAKU HIROTA, YUKIO KITADE, SHIGEO SENDA

ウラシルと6-アミノウラシルとの反応。ピリミジン-ピリジン環変換反応
を経るピリド [2,3-*d*] ピリミジン類の新規合成

広田耕作, 北出幸夫, 千田重男

ウラシルと α -置換酢酸アミドなどの鎖状の N-C-C 型求核試薬との反応によりピリジン環に変換することが知られている。今回はウラシル類(1)と N-C-C 型環状求核試薬である6-アミノウラシル類(2)との反応により一工程でピリド [2,3-*d*] ピリミジン類(3)が生成することを見いだした。

1,3-dimethyluracil (1a) と 6-amino-1,3-dimethyluracil (2a) とを sodium の存在下に加熱還流すれば, (1a) がピリミジン環からピリジン環に変換した 1,3-dimethylpyrido [2,3-*d*] pyrimidine-2,4,7 (1H, 3H, 8H)-trione (3a) を与えた。同様にして, (1b-d) と (2a-c) との反応により生成した (3a-f) を表で示した。また 1,3-dimethyl-4-thiouracil (4) と (2a) との反応でも対応する(5)を与えた。

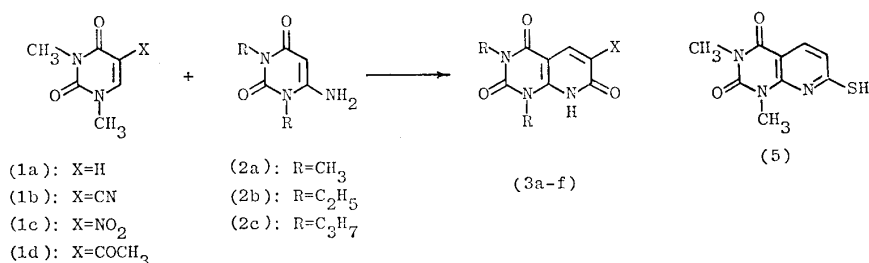


Table Formation of Pyrido[2,3-*d*]pyrimidines (3)

starting material	reaction* time (h)	product	X	R	mp. (°C)	yield (%)*
(1a) + (2a)	95	(3a)	H	CH ₃	288-289	33
(1b) + (2a)	5 (4)	(3b)	CN	CH ₃	>300	52 (63)
(1b) + (2b)	1	(3c)	CN	C ₂ H ₅	294-295	65
(1b) + (2c)	2	(3d)	CN	C ₃ H ₇	264-265	63
(1c) + (2a)	3 (3)	(3e)	NO ₂	CH ₃	239-240	34 (50)
(1d) + (2a)	(9)	(3f)	COCH ₃	CH ₃	242-243	(65)

* When potassium hydroxide instead of sodium ethoxide was used as a base, the reaction time and yield given in parentheses were applied and resulted, respectively.