Vol. 29

(J. Org. Chem., 44, 970 (1979))

Pyrimidine Derivatives and Related Compounds. 32*. Acid-Catalyzed Hydrolysis of 1,3-Disubstituted 6-Carbamoyl(or Cyano)uracils.

N(1)-and N(3)-Dealkylation of Uracils

SHIGEO SENDA, KOSAKU HIROTA, TETSUJI ASAO

ピリミジン誘導体及びその関連化合物について.第32報*. 1,3-disubstituted 6-carbamoyl (cyano) uracil 類の酸 触媒による加水分解反応

千田重男, 広田耕作, 浅尾哲次

1位および3位に二級アルキル基の置換した 6-carbamoyluracil 類あるいは 6-cyanouracil 類は酸触媒脱アルキル化反応を受けることを見い出した。1-sec-alkyl-6-carbamoyl-3-methyluracil (1a-c) を48% HBr 中で加水分解すれば脱 N(1)-アルキル化反応が同時に進行し 3-methylorotic acid (2) が生成した。なお,(1a-c)を濃硫酸中で加熱すれば脱アルキル化のみが進行して 6-carbamoyl-3-methyluracil (3) が得られた。また (3) は同条件下1-sec-alkyl-6-cyano-3-methyluracil (4a-c) からも生成した。つぎに 3-sec-alkyl-6-carbamoyl-1-methyluracil

の場合にも脱 N(3)-アルキル化が進行 したがこの場合は脱 N(1)-アルキル化反応 と比較してより強い反応条件を必要とした。

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ O & N \\ O & N \\ CONH_{2} \end{array} \rightarrow \begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CO_{2}H \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

$$\begin{array}{c} CH_{3} & O \\ N & CN \\ \end{array}$$

a, R = c-C₆H₁₁; b, R = *i*-C₃H₇; c, R = sec-C₄H₉; d, R = CH₃; e, R = C₃H₇; f, R = C₄H₉; g, R = C₆H₅CH₂

^{*} 第31報: J. Am. Chem. Soc., 100, 7661 (1978).