

[J. Am. Chem. Soc., 101, 4423 (1979)]

**A Novel Pyrimidine to Pyridine Ring Transformation Reaction.
A Facile Synthesis of 2,6-Dihydroxypyridines***

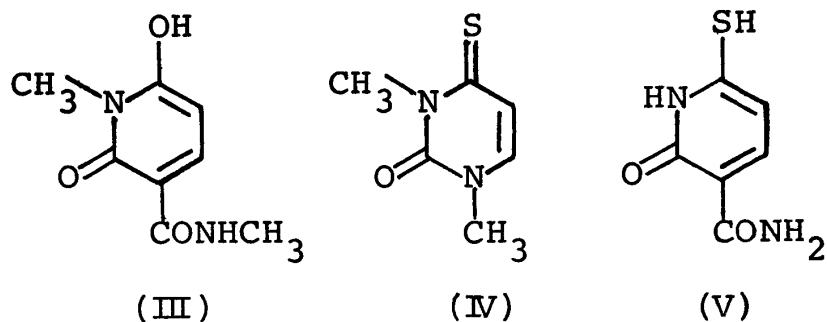
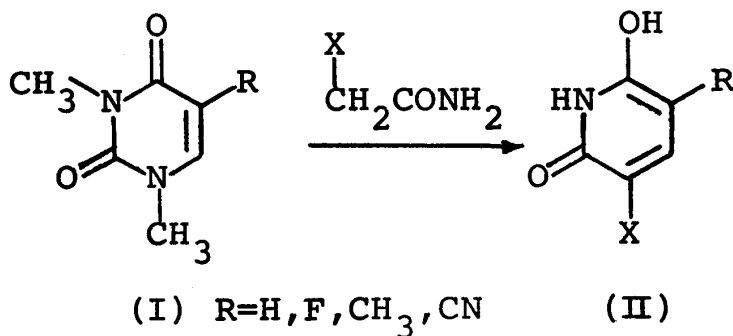
KOSAKU HIROTA, YUKIO KITADE, SHIGEO SENDA, MICHAEL J. HALAT**,
KYOICHI A. WATANABE**, JACK J. FOX**

ピリミジンからピリジンへの新環変換反応・2,6-ジヒドロキシピ
リジン類の簡便な合成法

広田耕作, 北出幸夫, 千田重男, MICHAEL J. HALAT**,
KYOICHI A. WATANABE**, JACK J. FOX**

ピリミジンの N₁-C₂-N₃ 部分が α-置換酢酸アミド類などの 1,3-ambident 求核試薬の C-C-N 部分と直接入れ換わる新しい型のピリミジン環からピリジン環への環変換反応を見出した。

1,3-dimethyluracil 誘導体(I)を NaOEt の存在下にマロンアミドと加熱還流すれば, 2,6-dihydroxynicotina-mide (II : X=CONH₂) に好収率で環変換した。求核試薬としてシアノ酢酸アミド, アセト酢酸アミド, フェニル酢酸アミドを用いて同条件下に反応した場合も対応する環変換生成物 (II : X=CN, COCH₃, C₆H₅) が生成した。さらに(I)と N, N' ジメチルマロンアミドとの反応では 1-メチル体(III)を得た。一方, 4-thiouracil 誘導体(IV)にマロンアミドを同様に反応させても対応する 6-チオール体(V)に環変換した。



* 第14報 : J. Org. Chem., 43, 1193 (1978).

** Sloan-Kettering Institute for Cancer Research (New York).