Tetrahedron Letters No.14, pp. 795-797, 1964. Pergamon Press Ltd. Printed in Great Britain.

5-AMINO-1,2,3-THIADIAZOLE

J.Goerdeler und G.Gnad

Organisch-Chemisches Institut der Universität Bonn (Received 17 February 1964)

Die gute Verwendbarkeit der Acyl-Senföle, insbesondere des Carbophenoxy-senföls, zur Darstellung von Amino-isothiazolen¹ gab Veranlassung, die Synthese von H.v.Pechmann und A.Nold² (Diazomethan + Phenylsenföl) zur Gewinnung der bisher unbekannten primären Amine II auszuarbeiten³:

Die Synthese ist weitreichend, sie gelingt auch mit Diazoalkanen (Diazoessigestern!), die mit Phenylsenföl nicht reagieren⁴. Gewöhnliche Acylreste lassen sich aus I nicht ohne Ringveränderung, über die gesondert berichtet werden wird, entfernen; bei den Carbophenoxy-aminen erfolgt die Entacylierung bereits beim kurzen Erhitzen mit schwachen Basen.

Die Amine II sind farblose, stabile, wenig basische Verbindungen. Sie lassen sich acylieren (zu I), sulfonylieren (zu 5-Sulfonamido-thiadiazolen), nitrosieren und diazotieren (Kupplung; zu Farbstoffen). Auf dem Diazoweg wurde eine Reihe weiterer in 5-Stellung substituierter 1,2,3-Thiadiazole erhalten, über die an anderer Stelle berichtet werden soll.

Tabelle 1
5-Acylamino-1,2,3-thiadiazole (I)

R	R,	Charakteristik	Fp (Kofler-Bank)
H	CH ₃	Nadeln	2120
н	OC ₆ H ₅	Plättchen	242 ⁰ (Zers.)
CH ₃	C ₆ H ₅	Nadeln	142 ⁰
CH ₃	OC ₆ H ₅	Nadeln	190° (Zers.)
C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	Nadeln	172°
CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	Plättchen	197°
CO ₂ C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	Prismen	185°
CO ₂ C ₂ H ₅	OC ₆ H ₅	Plättchen	156 ⁰
CO ₂ C ₄ H ₉ tert.	OC ₆ H ₅	Nadeln	182 ⁰ (Zers.)
CONH ₂	C ₆ H ₅	Nadeln	272° (Zers.)
COC ₆ H ₅	OC ₆ H ₅	Nadeln od. Rhomben,die sich am Licht verfärben	181 ⁰ (Zers.)

Tabelle 2
5-Amino-1,2,3-thiadiazole (II)

R	Charakteristik	Fp (Kofler-Bank)
Н	Nadeln	152° (Zers.)
CH3	Nadeln	102°
CO ₂ C ₂ H ₅	Nadeln	126°
CO ₂ C ₄ H ₉ tert.	Nadeln	142°
CO ₂ H	feinkrist.Pulver	ca.250° (starke Zers.)
COC ₆ H ₅	Stäbchen	161°

LITERATUR

- J.Goerdeler und H.W.Pohland, Chem.Ber. 96, 526 (1963)
- Ber.Dtsch.Chem.Ges. 28, 861 (1895), 29, 2588 (1896)
- Siehe auch Vortragsreferat J.Goerdeler, Angew.Chemie
 75, 941 (1963)
- Vergleiche hierzu M. Tisler, M. Hrovat und N. Machiedo, <u>Kroatica Chemica Acta</u> 34, 183 (1963)