

Jean-Louis Barascut, Bernard L. Kam et Jean-Louis Imbach

Laboratoire de Chimie Bio-Organique, Université des Sciences et Techniques du Languedoc, Place Eugène Bataillon, 34060 Montpellier Cédex, France

Reçu le 9 Mars 1977

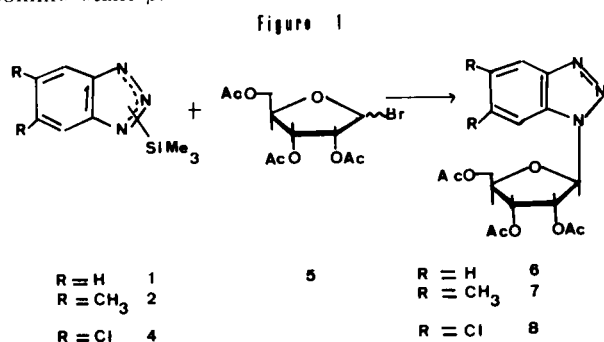
Grâce au choix de certains paramètres réactionnels, de la réaction de fusion acido-catalysée, notamment du pourcentage de catalyseur, nous avons synthétisé divers nucléosides des séries benzotriazole et benzimidazole. Cette approche nous a permis d'obtenir pour la première fois les nucléosides N-2 substitués ainsi que les anomères α substitués en N-1 correspondant à ces aglycones. Nous avons ainsi montré qu'il était possible d'augmenter la sélectivité de la réaction de fusion acido-catalysée.

J. Heterocyclic Chem., 14, 1305 (1977)

Introduction.

Nous avons montré récemment, sur un exemple précis (1), qu'il était possible de conférer une certaine sélectivité à la réaction de fusion par un choix judicieux des conditions expérimentales, notamment de la quantité de catalyseur.

Afin d'étudier le domaine d'utilisation de cette approche, nous l'avons appliquée aux différents benzoazoles 1 à 3. En effet, la synthèse des ribofuranonucléosides des benzoazoles n'a pas jusqu'à maintenant été envisagée par la réaction de fusion avec un sucre acétylé et les divers isomères et anomères possibles n'étaient pas tous connus. En fait, seule la condensation des dérivés triméthylsilylés des benzotriazoles 1, 2, et 4 avec le bromo-1-tri-*O*-acétyl-2,3,5-*D*-ribofuranose (5) a été effectuée par Townsend et Coll. (2) en présence d'iodure de sodium comme catalyseur (Figure 1). Dans chaque cas, un seul nucléoside a été isolé, sa structure déterminée comme étant N-1 et son anomérie postulée comme étant β .



Concernant le benzimidazole (3), les seuls essais de fusion effectués avec le tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -*D*-ribofuranose (9) ont été décrits comme ne conduisant à aucun résultat (3), alors que la réaction de fusion en présence de tri-*O*-acétyl-1,3,5 désoxy-2-*D*-ribofuranose permet d'obtenir 66% de désoxy-2'-*D*-ribofuranosylbenzimidazole sous forme d'un mélange d'anomères (4).

Ainsi donc, dans le double but de parvenir aux nucléosides des benzoazoles non encore décrits et d'étudier l'extension de nos précédents travaux, nous examinerons successivement la fusion des benzotriazoles 1 et 2, puis celles du benzimidazole (3) avec le tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5-*D*-ribofuranose (9).

Résultats et discussion.

a) Fusion du benzotriazole (1) et du diméthyl-5,6 benzotriazole (2) avec le tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -*D*-ribofuranose (9).

Nous avons tout d'abord synthétisé et caractérisé les différents nucléosides en effectuant la fusion de 1 ou 2 et de 9 à 160°, pendant 10 minutes sous un vide de 20 mm de Hg avec 1,4% en mole d'acide *p*-toluène sulfonique: conditions standard définies précédemment (1).

Dans chaque cas, les rendements sont pratiquement quantitatifs et les mélanges réactionnels bruts sont analysés par ccm et par rmn. Ainsi, pour 1 et 2 les spectres de rmn du mélange réactionnel brut, pris dans l'acétonitrile, présentent, dans chaque cas, deux doublets ($\delta = 7,00$ ppm, $J = 4,8$ Hz; $\delta = 6,5$ ppm, $J = 3,6$ Hz) attribuables chacun au proton anomère d'un nucléoside dans le rapport 1/4. Par contre, l'analyse de chaque mélange par ccm révèle la présence de trois tâches correspondant chacune à un nucléoside. La séparation par chromatographie sur colonne de gel de silice conduit dans chaque cas à trois nucléosides 6, 10, 11 pour 1 et 7, 18, 19 pour 2 (Figure 2).

Chacune des fractions est ensuite désacétylée par une solution méthanolique saturée d'ammoniac pour conduire respectivement à 12, 13, 14 et 20, 21, 22.

La comparaison des spectres uv des composés ainsi obtenus avec ceux des dérivés *N*-méthylés correspondants (5) montre que 14 et 22 sont substitués sur l'atome d'azote N-2 alors que 12, 13 et 20, 21 sont N-1 substitués (Tableau 1). De plus, ceci indique que 12, 13 et 20, 21 sont deux paires de nucléosides anomères.

Pour la paire d'anomère 12, 13 la configuration

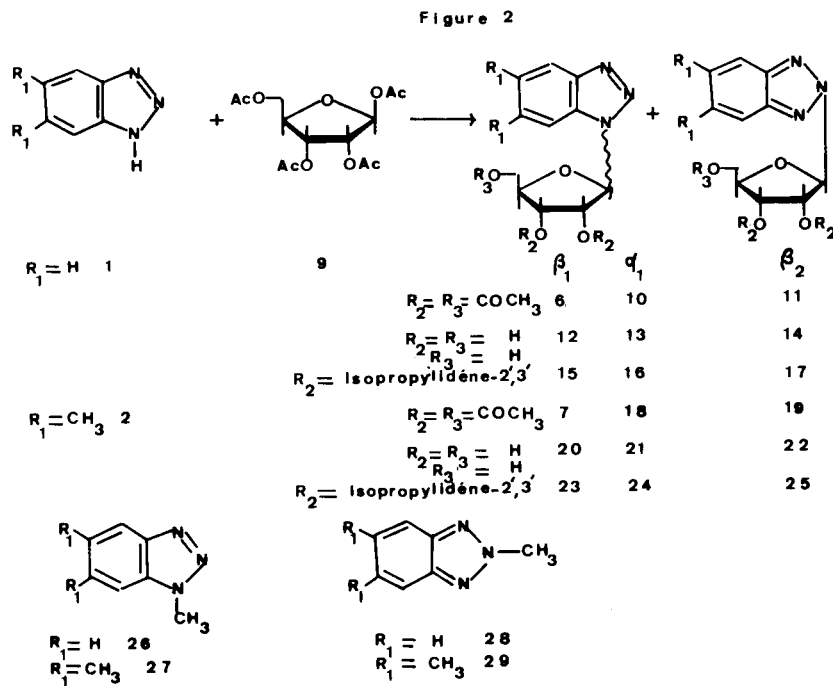


Tableau 1

Spectres de rnm des nucléosides des benzotriazoles **1** et **2** dans le DMSO- d_6

	H-1'	H-4-7	H-5-6	Me 5-6	$J_{1'2'}$ (Hz)	Isopropylidène-2',3'	$\Delta \delta$
12	6,23	7,53 (m)	8,08 (m)		5,4		
13	6,70	7,40 (m)	7,90 (m)		4,2		
14	6,23	6,98 (m)	7,47 (m)		3,4		
15	6,80		7,64-8,20		1,6	1,42-1,60	0,18
16	6,90 (m)		7,64-8,20			1,20	0,0
17	6,80		7,58-8,03		1,2	1,40-1,58	0,18
20	6,33	7,83		2,42 (s)	5,4		
21	6,77	7,65 (s)		2,40 (s)	4,2		
		7,71 (s)					
22	6,15	7,68 (s)		2,43 (s)	3,4		
23	6,60	7,83 (s)		2,43 (s)	1,6	1,42 (s) 1,60 (s)	0,18
24	6,88	7,67 (s)		2,40 (s)		1,20 (s)	0,0
		7,77 (s)					

Spectres uv des nucléosides et des dérivés méthylés de **1** et **2** dans le méthanol

	λ	ϵ		λ	ϵ		λ	ϵ		λ	ϵ
14	275	7500	12 (2)	253	7340	26 (5)	255	6457	13	254	7200
	281	8125		280	4100		283	4786		280	3920
	285*	6250									265 6430
											279 4600
21	266	6500	28 (5)	275	7943	29 (5)	284	10800	22	284	12700
	280	4750					293	9000		293*	11725
											265 6850
											286 5200

* épaulement

anomère α a été attribuée au nucléoside **13** dont le signal du proton H-1' est le plus déblindé (7), **12** est donc l'anomère β . De la même façon, **20** est de configuration β alors que **21** est l'anomère α (Tableau 1).

Ces attributions sont confirmées grâce au critère mis au point au laboratoire (8,9): en effet, les dérivés *O*-isopropylidène-2',3' **16** et **24** présentent un $\Delta \delta = 0,0$ ppm, alors que $\Delta \delta = 0,18$ ppm pour les dérivés *O*-isopropylidènes **15** et **23** correspondant à **12** et **20** (Tableau 1).

Ceci nous permet par ailleurs de confirmer la configuration β pour les nucléosides **12** et **20** obtenus précédemment par Townsend et Coll. (2) *via* les dérivés triméthylsilylés de **1** et **2**.

Quant aux produits **14** et **22**, il n'est pas possible de leur attribuer une configuration anomère certaine, ni en examinant les déplacements chimiques de leurs protons anomères, ni sur la base de leurs constantes de couplage $J_{1',2'}$, celles-ci étant supérieures à 1 Hz (10-12). Mais l'analyse par rmn des dérivés *O*-isopropylidènes-2',3' **17** et **25** correspondants montre que $\Delta\delta > 0,15$ ppm, ce qui est sans ambiguïté en accord avec une configuration β pour **14** et **22** (8,9).

Ainsi, après avoir caractérisé sans ambiguïté trois nucléosides du benzotriazole (**1**) et du diméthyl-5,6 benzotriazole (**2**) nous pouvons maintenant étudier l'influence des conditions de la réaction sur la distribution des produits. En effet, nous avons montré précédemment (1) dans le cas de l'indazole que pour de faibles quantités de catalyseur (jusqu'à 1,5%), les isomères N-2 substitués étaient prédominants, alors qu'au delà de 7%, seuls les isomères N-1 sont formés.

Si nous examinons le tableau 2 concernant la fusion du benzotriazole (**1**) et du tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**) pour différents pourcentages en mole de catalyseur, nous constatons que le rendement global augmente et atteint 95% à partir de 1,4% d'acide *p*-toluène sulfonique. Parallèlement, le maximum d'isomère N-2 substitué est obtenu pour 1,4% de catalyseur. Par contre, pour 7% de catalyseur, la N-1 substitution est largement prépondérante.

Nous avons d'autre part, montré que **11** se transpose dans les conditions de la réaction de fusion et conduit à un mélange de **6**, **10**, **11** identique à ceux présentés dans le tableau 2 avec une prédominance de **6**.

Tableau 2

Fusion du benzotriazole (**1**) et du tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**) en fonction du pourcentage de catalyseur, à 160° pendant 10 minutes sous un vide de 20 mm de mercure.

% d'acide <i>p</i> -toluène sulfonique	Rendement global %	6	10	11	%N-1	%N-2
0,4	77	51	7	19	58	19
0,85	90	55	12	23	67	23
1,4	95	54	15	26	69	26
2,5	95	56	15	24	71	24
7	95	65	23	6	88	6

Dans le but d'augmenter la sélectivité de cette réaction, nous avons ensuite effectué la condensation précédente avec 7% de catalyseur mais à 180°. Dans ces conditions, on isole uniquement les nucléosides **6** et **10** mais avec un rendement de 36%. La diminution du rendement global est due à la décomposition du sucre à cette température. Nous avons bien ainsi augmenté la sélectivité de la réaction

puisque l'on note l'absence de substitution en N-2, mais au détriment du rendement.

Des remarques identiques peuvent être faites pour le diméthyl-5,6 benzotriazole (**2**).

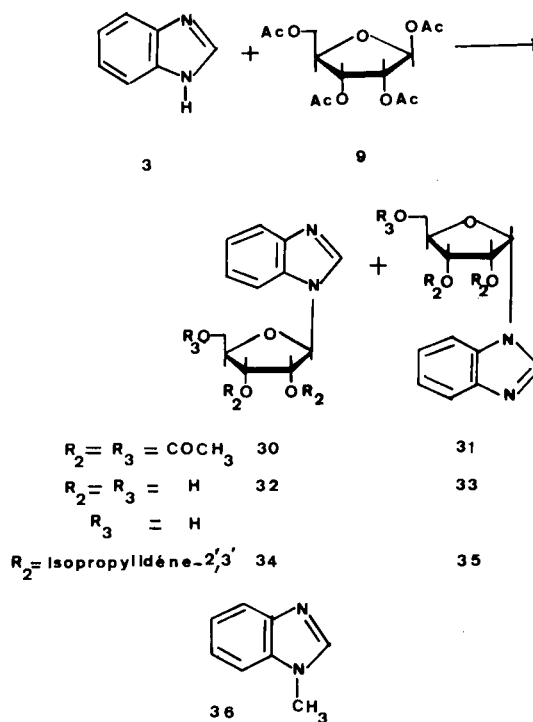
Il semblerait donc en accord avec nos résultats précédents (1) que les nucléosides N-2 substitués soient les produits cinétiques et les composés N-1 substitués thermodynamiquement les plus stables; d'autre part, on constate que la sélectivité de la réaction en N-1 augmente bien en fonction du pourcentage de catalyseur.

b) Fusion du benzimidazole (**3**) et du tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**).

L'obtention par Wittle et Robins (4) du di-*O*-acétyl-3',5'-désoxy-2'- β -D-ribofuranosylbenzimidazole par la méthode de fusion, nous a incités à reconsidérer la fusion acido-catalysée de **3** et **9** qui avait été précédemment décrite (3) comme ne conduisant à aucun résultat.

Afin tout d'abord d'isoler et d'identifier les nucléosides correspondants, nous avons effectué cette réaction en utilisant l'acide *p*-toluène sulfonique (12%) comme catalyseur à 175° pendant 20 minutes (Figure 3).

Figure 3



En fin de réaction, le mélange réactionnel brut est analysé par rmn et ccm. Le spectre de rmn dans l'acétonitrile révèle la présence de deux doublets attribuables chacun au proton anomère d'un nucléoside. La séparation par chromatographie sur colonne de gel de silice conduit à **30** et **31** qui sont ensuite désacétylés par une solution

Tableau 3

Spectres uv des nucléosides du benzimidazole dans le méthanol

	λ	ϵ		λ	ϵ		λ	ϵ
	249*	5890		254	5750		254	5125
	254	6025		263	6000		263	5420
36 (13)	266	4360	32	269	6875	33	269	6500
	274	5010		276	5950		276	5750
	281	5010						

* épaulement

Spectres de rmn des nucléosides isolés dans le DMSO-d₆

	H - l'	J _{1'2'} Hz	C(CH ₃) ₂	$\Delta \delta$ ppm
32	5,93 (d)	6,0		
33	6,32 (d)	5,0		
34	6,37 (d)	5,8	1,37-1,60	0,23
35	6,37 (m)		1,33	0,0

méthanolique saturée d'ammoniac pour conduire respectivement à **32** et **33**.

La comparaison de leurs spectres uv avec ceux du dérivé *N*-méthylé correspondant confirme l'obtention de deux *N*-nucléosides (Tableau 3).

De plus, l'examen des spectres de rmn (Tableau 3) nous permet donc d'attribuer la configuration α au nucléoside **33** dont le proton anomère est le plus déblindé (7). Une preuve supplémentaire est donnée par les spectres de rmn des dérivés isopropylidènes correspondants **34** et **35**; la différence de déplacement chimique entre les méthylés du cycle dioxolane étant de 0,0 ppm pour l'anomère **35** et de 0,23 ppm pour **34** (8,9).

Cependant, dans le but d'augmenter le rendement global et d'obtenir une meilleure proportion d'anomère α , cette condensation a été réalisée avec des pourcentages croissants de catalyseur (1).

Nous avons remarqué que à partir de 12% de catalyseur le rendement de la réaction (62%) ne varie pas sensiblement puisqu'il atteint 66% pour 20% de catalyseur. Parallèlement, la proportion des anomères α et β est

pratiquement constante, de l'ordre de: $\alpha/\beta = \frac{12}{50}$.

Ainsi, par cette méthode et, en tenant compte des résultats précédents (1), nous avons isolé et identifié sans ambiguïté les ribofuranonucléosides α et β du benzimidazole.

Il est à noter que par silylation (6) ou par la méthode aux sels de métaux lourds (14), seul l'anomère β a été décrit. Sa configuration qui avait été postulée est donc maintenant parfaitement déterminée.

Conclusion.

Nous avons appliqué à la synthèse des ribofuranonucléosides des benzoazoles les résultats obtenus concernant la fusion acido-catalysée de l'indazole (1). Par

un choix convenable des conditions expérimentales, il nous a été possible de parvenir aux nucléosides correspondants, qui ont été isolés et caractérisés sans ambiguïté.

Ainsi nous avons montré que la condensation du benzimidazole (**3**) et du tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**) conduit bien aux ribofuranonucléosides α et β correspondants contrairement aux conclusions de la littérature (3).

Dans le cas des benzotriazoles lorsque la réaction de fusion est effectuée dans des conditions douces (faible quantité de catalyseur, température peu élevée) les isomères cinétiques sont obtenus dans des proportions non négligeables. Si, par contre, la réaction de fusion est réalisée dans des conditions plus poussées, les isomères thermodynamiques sont obtenus seuls, ou prédominent fortement.

Ces résultats montrent donc que par un choix judicieux des paramètres réactionnels, il est possible non seulement d'optimiser les rendements de la réaction de fusion, mais aussi de lui conférer une certaine sélectivité, ce qui est en accord avec nos résultats précédents (1).

PARTIE EXPERIMENTALE

Indications générales.

Les points de fusion non corrigés ont été pris en capillaire. Les spectres de rmn sont enregistrés sur un spectromètre Varian T 60. Les déplacements chimiques sont exprimés en ppm. Les chromatographies sur couches minces sont faites sur plaque de silice Kodak-6060 "Silica gel" avec indicateur fluorescent. Les spots sont révélés à l'uv. Les chromatographies sur colonne sont réalisées avec de la silice Merck (0,063-0,2 mm). Les analyses sont effectuées par le Service Central de Microanalyse de CNRS à l'Ecole Nationale Supérieure de Chimie de Montpellier.

Conditions générales des réactions de fusion.

Un mélange équimoléculaire d'hétérocycle **1** à **3** et de tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**), pesé à $\pm 0,1$ mg est introduit dans un ballon rodé. Ce dernier est plongé dans un bain d'huile préchauffé à une température thermostatiquement contrôlée à $\pm 0,5$ près. Au mélange fondu, on ajoute la quantité requise d'acide *p*-toluène sulfonique pesée à $\pm 0,01$ mg. Les temps de réaction sont mesurés à partir de l'introduction du catalyseur. Le vide appliqué est de 20 mm de mercure. En fin de réaction, le mélange réactionnel brut est analysé par ccm et par rmn.

Les rendements sont déterminés par intégration sur le spectre rmn des protons caractéristiques. Comme précédemment (1) nous avons vérifié que les valeurs trouvées étaient cohérentes aux erreurs d'expérience près avec celles déterminées après séparation des produits par chromatographie sur colonne.

1) Ribofuranonucléosides du benzotriazole (**1**).

Un mélange équimoléculaire de 10 mmoles (1,2 g) de benzotriazole (**1**) et de tétra-*O*-acétyl-1,2,3,5- β -D-ribofuranose (**9**) est fondu à 160° pendant 10 minutes sous vide en présence de 1,4% en mole d'acide *p*-toluène sulfonique. Le vide est ensuite maintenu 10 minutes supplémentaires pour ôter le maximum d'acide acétique formé.

L'huile ainsi obtenue est dissoute dans 10 ml d'acétonitrile et décolorée. Après évaporation du solvant sous vide on obtient un résidu huileux.

Par chromatographie sur colonne de gel de silice (chloroforme-éther=1/1) de cette huile, nous obtenons par ordre d'éluion **10** (24%), **6** (55%) et **11** (14%).

Chaque nucléoside est ensuite dissous dans 50 ml d'une solution de méthanol saturée d'ammoniac et abandonné à température ambiante pendant 20 heures. Le solvant est ensuite évaporé et l'huile résultante purifiée par filtration sur colonne de gel de silice. On obtient ainsi:

-le β -D-ribofuranosyl-2 benzotriazole (**14**) sous forme d'huile.

Anal. Calculé pour $C_{11}H_{13}N_3O_4$: C, 52,64; H, 5,22; N, 16,74. Trouvé: C, 52,75; H, 5,07; N, 16,51.

-le β -D-ribofuranosyl-1 benzotriazole (**12**) F = 135-136° (éthanol), Litt. (2) F = 135°.

Anal. Calculé pour $C_{11}H_{13}N_3O_4$: C, 52,64; H, 5,2; N, 16,74. Trouvé: C, 52,83; H, 5,17; N, 16,83.

-l' α -D-ribofuranosyl-1 benzotriazole (**13**) sous forme d'huile.

Anal. Calculé pour $C_{11}H_{13}N_3O_4$: C, 52,64; H, 5,22; N, 16,74. Trouvé: C, 52,80; H, 5,11; N, 16,62.

II) Ribofuranonucléosides du diméthyl-5,6-benzotriazole (**2**).

La réaction de fusion est effectuée dans les mêmes conditions que précédemment. Par chromatographie sur colonne de gel de silice (chloroforme-éther 1/1), nous obtenons trois nucléosides: Le (tri-O-acétyl-2',3',5'- β -D-ribofuranosyl) 2-diméthyl-5,6 benzotriazole (**19**) (25%); le (tri-O-acétyl-2',3',5'- β -D-ribofuranosyl)-1 diméthyl-5,6 benzotriazole (**7**) 55% et le (tri-O-acétyl-2',3',5'- α -D-ribofuranosyl)-1 diméthyl-5,6 benzotriazole (**18**) (14%).

Chaque nucléoside est désacétylé par une solution de méthanol saturé d'ammoniac et traité comme précédemment. On obtient:

-le β -D-ribofuranosyl-2 diméthyl-5,6 benzotriazole (**22**), F = 141-143° (chloroforme).

Anal. Calculé pour $C_{13}H_{17}N_3O_4$: C, 56,0; H, 6,11; N, 15,05. Trouvé: C, 55,75; H, 6,13; N, 15,10.

-le α -D-ribofuranosyl-1 diméthyl-5,6 benzotriazole (**21**), F = 170-171° (acétonitrile).

Anal. Calculé pour $C_{13}H_{17}N_3O_4$: C, 56,0; H, 6,11; N, 15,05. Trouvé: C, 56,06; H, 6,09; N, 15,28.

-le β -D-ribofuranosyl-1 diméthyl-5,6 benzotriazole (**20**), F = 179-181° (eau/éthanol 3/2), litt (2), F = 180°.

Anal. Calculé pour $C_{13}H_{17}N_3O_4$: C, 56,0; H, 6,11; N, 15,05. Trouvé: C, 55,91; H, 6,05; N, 14,92.

III) Ribofuranonucléosides du benzimidazole (**3**).

Un mélange équimoléculaire (10 mmoles) de benzimidazole (**3**) et de **9** est fondu à 175° sous vide pendant 20 minutes en présence de 18% d'acide *p*-toluène sulfonique. En fin de réaction le vide est maintenu 10 minutes supplémentaires pour éliminer l'acide acétique formé au cours de la réaction.

Le résidu est chromatographié sur une colonne de gel de silice (chloroforme-éther 1/1). Deux nucléosides sont ainsi obtenus:

-le (tri-O-acétyl-2',3',5'- β -D-ribofuranosyl)-1 benzimidazole (**30**) et le (tri-O-acétyl-2',3',5'- α -D-ribofuranosyl)-1 benzimidazole (**31**).

La désacétylation de **30** et **31** par une solution de méthanol saturé d'ammoniac conduit respectivement au:

-(β -D-ribofuranosyl)-1 benzimidazole (**32**), F = 166-168° (eau), Litt (6) F = 168°.

Anal. Calculé pour $C_{12}H_{14}O_4N_2$: C, 57,60; H, 5,64; N, 11,20. Trouvé: C, 57,39; H, 5,68; N, 11,07.

-(α -D-ribofuranosyl)-1 benzimidazole (**33**) F = 172-171° (éthanol-chloroforme 1/9).

Anal. Calculé pour $C_{12}H_{14}O_4N_2$: C, 57,60; H, 5,64; N,

11,20. Trouvé: C, 57,70; H, 5,60; N, 11,30.

IV) Synthèse des dérivés *O*-isopropylidène-2',3' des nucléosides du benzotriazole (**1**) et du diméthyl-1-5,6 benzotriazole (**2**) et du benzimidazole (**3**).

A 0,012 moles de nucléoside est ajouté un mélange de 2 ml d'acétone anhydre et de 2 ml de diméthoxy-2,2 propane. A la solution ainsi obtenue, est ajouté 3 mg d'acide *p*-toluène sulfonique. Celle ci est alors abandonnée sous agitation à température ambiante pendant respectivement 30 minutes, 2 h et 24 heures.

Le solvant est ensuite évaporé et l'huile obtenue coévaporée avec du tétrachlorure de carbone. Le spectre de rmn dans le DMSO- d_6 du dérivé *O*-isopropylidène-2',3' ainsi obtenu est directement enregistré.

Remerciements.

Nous remercions la Caisse Nationale de l'Assurance-Maladie des Travailleurs Salariés pour l'aide qu'elle a apportée à la réalisation de ce travail.

BIBLIOGRAPHIE ET NOTES

- (1) J.-L. Barascut, B. L. Kam et J.-L. Imbach, *Bull. Soc. Chim. France*, 1983 (1976).
- (2) G. R. Revankar et L. B. Townsend, *J. Heterocyclic Chem.*, **5**, 785 (1968).
- (3) L. B. Townsend et G. R. Revankar, *Chem. Rev.*, **70**, 389 (1970).
- (4) C. P. Wittle et R. K. Robins, *J. Am. Chem. Soc.*, **87**, 4940 (1965).
- (5) M. Fuertes, G. García-Muñoz, F. G. De Las Heras, R. Madronero, M. Stud et M. Rico, *Tetrahedron Letters*, 4099 (1972).
- (6) G. R. Revankar et L. B. Townsend, *J. Heterocyclic Chem.*, **5**, 477 (1968); *ibid.*, **5**, 615 (1968).
- (7) J. D. Stevens et H. G. Fletcher Jr., *J. Org. Chem.*, **33**, 1799 (1968).
- (8) J.-L. Imbach, J.-L. Barascut, B. L. Kam et C. Tapiero, *Tetrahedron Letters*, 129 (1974).
- (9) J.-L. Imbach, J.-L. Barascut, B. L. Kam, B. Rayner, C. Tamby et C. Tapiero, *J. Heterocyclic Chem.*, **10**, 1069 (1973).
- (10) J. D. Stevens, R. K. Ness et H. G. Fletcher Jr., *J. Org. Chem.*, **33**, 1806 (1968).
- (11) F. E. Hruska, A. A. Grey et J. C. Smith, *J. Am. Chem. Soc.*, **92**, 4088 (1970).
- (12) Pour une revue voir: L. B. Townsend, in "Synthetic Procedures in Nucleic Acid Chemistry," Eds., N. W. Zorbach et R. S. Tipson, Wiley Interscience, New York, N.Y., **2**, 333 (1973).
- (13) G. Leandri, A. Mangini, F. Montanari et R. Passerini, *Gaz. Chim. Ital.*, **70**, 769 (1955).
- (14) J. Davoll, B. Lythgoe et A. R. Todd, *J. Chem. Soc. (C)*, 967 (1948).

English Summary.

By a judicious choice of the fusion reaction parameters, mainly the percentage of catalyst, we have obtained the corresponding benzotriazole and benzimidazole nucleosides substituted at N-2. We have also obtained the α -N-1 anomers. Thus, we have shown it is possible to confer some selectivity to the acid-catalyzed fusion-reaction.