

Alfred Kreutzberger* ** und Michael Loch***

Institut für Pharmazie der Johannes Gutenberg-Universität Mainz, Saarstraße 21,
D-6500 Mainz, West Germany
Eingegangen am 9. Juni 1986

Die die Anlagerung von Acrylnitril (**2**) beinhaltende Cyanethylierung des Butyroguanamins (**1**) führt zu den cyanethylierten Propyl-1,3,5-triazinen **3**, **4** und **5**. Spektroskopisch äußerst charakteristisch für diese Strukturen ist in den IR-Spektren die scharfe Bande der $C \equiv N$ -Valenzschwingung bei 2260 cm^{-1} . Kennzeichnend in den Massenspektren ist die Abspaltung eines Cyanethylradikals. Während **4** antikonvulsive und cytoprotektive Effekte auszulösen vermag, ist **5** Träger neuroleptischer und herbizider Wirksamkeit.

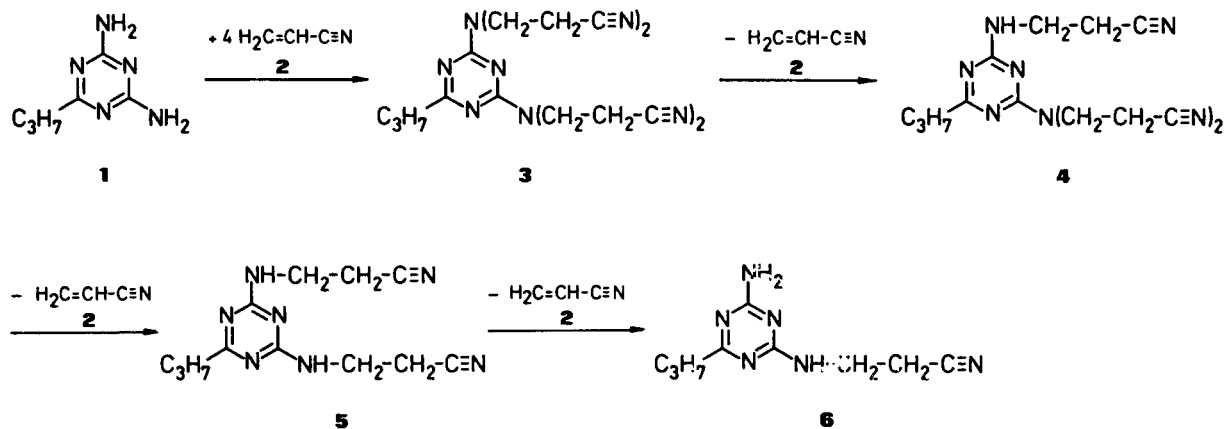
J. Heterocyclic Chem., **24**, 1697 (1987).

In Fortsetzung unserer Untersuchungen zur Weiterentwicklung von Antikonvulsiva [1] und in Anlehnung an das Prinzip des Stickstoffheterocyclus als wesentliches Strukturelement in einer Reihe von bekannten Vertretern dieser Wirkstoffgruppe [2], wie Barbituraten und Hydantoinen, ist das 1,3,5-Triazinsystem, hier speziell das Butyroguanamin (**1**), in den Mittelpunkt der vorliegenden Studie gestellt worden. Nachdem an verschiedenen 1,3,5-Triazinderivaten, wie **1** [1,3] und 2,4-Dichlor-6-(dihexylamino)-1,3,5-triazin [4,5], Reaktionsbedingungen zur gezielten Substitution erarbeitet worden waren, sollte nunmehr die Zugänglichkeit von **1** zu Additionsreaktionen näher untersucht werden.

Das für diese Untersuchungen im Hinblick auf Antikonvulsiva mit ungesättigten Seitenketten, wie Allomethadion [6], gewählte Acrylnitril (**2**) verhält sich gegenüber **1** äußerst reaktionsfreudig, indem sich in Gegenwart von Kaliumhydroxid bei erhöhter Reaktionstemperatur und tropfenweiser Zugabe von **2** ein Substanzgemisch bildet. Dahingegen läßt sich durch schnelle Zugabe von **2** zum Reaktionsgemisch eine vierfache Cyanethylierung durch Isolierung von 2,4-Bis[bis(cyanethyl)amino]-6-propyl-1,3,5-

triazin (**3**) realisieren. Die Ursache dafür, daß sich bei rascher Zugabe von **2** im molaren Verhältnis von 1:1 das 1:4-Addukt bildet, ist in der schlechten Löslichkeit von **1** und der guten Mischbarkeit von **2** in diesem Lösungsmittel zu suchen. Bedingt hierdurch, liegt in Acetonitril nach rascher Zugabe von **2** dieses im Überschuß vor und tritt unverzüglich in Reaktion. Eine Vergrößerung der Ausbeute an **3** kann jedoch durch Verlängerung der Reaktionszeit und Erniedrigung der Kaliumhydroxid-Konzentration erreicht werden.

Wesentlich für das Gelingen der Isolierung von **3** ist der kurzzeitige Abbruch der Reaktion. Die Gewinnung der anderen möglichen Additionsprodukte kann durch schnelle Zugabe von **2** zum Reaktionsgemisch, Erhöhung der Kaliumhydroxid-Menge auf das 10-fache und Steigerung der Reaktionstemperatur bis zum Siedepunkt erreicht werden. Unter diesen Reaktionsbedingungen kann durch Abbruch der Reaktion nach 2 Minuten Verbindung **3**, nach 20 Minuten das 1:3-Addukt **4** und nach 90 Minuten das 1:2 Addukt **5** erhalten werden. Nur unter genauer Einhaltung der Reaktionsbedingungen ergibt sich eine gute Reproduzierbarkeit. Die jeweils optimalen Zeiten bis



Formelschema

zum Reaktionsabbruch konnten dünnschichtchromatographisch ermittelt werden. Für den Reaktionsmechanismus ist primär das 1:4-Addukt **3** in Betracht zu ziehen, das sich sehr rasch bildet und deshalb nach kurzer Reaktionszeit isoliert werden kann. Anschließend baut sich dieses Produkt unter Abspaltung von zunächst einem Molekül Acrylnitril zu Verbindung **4** und schließlich unter Abspaltung eines weiteren Moleküls Acrylnitril zu **5** ab. Das 1:2-Addukt (**5**) ist sehr stabil, und es ist nach längerer Reaktionszeit nicht möglich, das 1:1-Addukt (**6**) zu isolieren.

Dieser Reaktionsverlauf vollzieht sich nur bei Einsatz einer größeren Menge an Kaliumhydroxid und bei Siedetemperatur. Beide Faktoren ermöglichen erst die Rückreaktion durch Abspaltung von Acrylnitril. In Parallele hierzu steht die Labilität der Biscyanethylgruppe in den Biscyanethylamino-Derivaten von Carbonsäuren, wie *N,N*-Biscyanethylglycin [7,8].

Die neu entwickelten Strukturen **3-5** werden durch die spektroskopischen Daten gestützt. So zeigen die IR-Spektren von **3-5** als charakteristische Gemeinsamkeit die Banden der CH-Valenzschwingungen der aliphatisch gebundenen H-Atome im Wellenzahlenbereich von 2880-2980 cm^{-1} und der CH-Deformationsschwingungen zwischen 1470-1375 cm^{-1} . Ferner tritt die scharfe Bande der $\text{C}\equiv\text{N}$ -Valenzschwingung bei 2260 cm^{-1} auf, die mit steigender Zahl von Cyanogruppen im Molekül an Intensität zunimmt. Die Banden des konjugiert cyclischen Triazinringsystems liegen zwischen 1500-1565 cm^{-1} und bei 830 cm^{-1} und stellen die stärksten Banden im Spektrum dar. Bei Verbindung **5** erscheint nur eine einzige breite Bande bei 1550 cm^{-1} , bei **3** ist diese in zwei und bei **4** in drei Banden aufgespalten.

Das IR-Spektrum von Verbindung **5** zeigt aufgrund von Wasserstoffbrückenbindungen 2 Banden für die NH-Valenzschwingung der sekundären Aminogruppe [9]. Diese liegen bei 3260 cm^{-1} und 3120 cm^{-1} . Bei Verbindung **4** ist die Absorption bei kleinerer Wellenzahl aufgespalten in 3 Banden. Für die NH-Deformationsschwingung [10] wird eine starke Bande bei 1625 cm^{-1} (**5**) bzw. 1605 cm^{-1} (**4**) gefunden, die bei sekundären Aminen gewöhnlich schwach auftritt. Diese tritt auch bei vergleichbaren Triazin-Derivaten auf und ist nicht mehr sichtbar nach Austausch der Aminoprotonen durch Cyanethylgruppen (**3**). $^1\text{H-NMR}$ -spektroskopische Daten sind zur weiteren Sicherung der Strukturen **3-5** herangezogen worden. Die Propylgruppe manifestiert sich bei $\delta = 0,9$ ppm durch das Triplett der Methylprotonen mit dem Integral von 3 Protonen und bei $\delta = 1,7$ ppm durch das Multiplett der Protonen der mittelständigen Methylengruppe, dessen Integral 2 Protonen entspricht. Die Protonen der ringständigen Methylengruppe zeigen eine Tieffeldverschiebung mit steigender Anzahl von Cyanogruppen im Molekül von $\delta = 2,38-2,48$

ppm. Die Kopplungskonstante dieser Resonanzsignale beträgt $J = 7$ Hz. Aufgrund des symmetrischen Baues der Verbindungen **3** und **5** treten bei tieferem Feld nur 2 Triplets für die Protonen der Methylengruppen der Cyanethylgruppen auf: bei 2,76 ppm (**5**) bzw. 2,88 ppm (**3**) für die Methylprotonen, die der Cyangruppe benachbart stehen, und bei 3,43 ppm (**5**) bzw. 3,88 ppm (**3**) für die Protonen der zweiten Methylengruppe. Die in **5** auftretende Verzerrung des zweiten Triplets läßt sich auf eine Kopplung mit dem Proton der benachbarten Aminogruppe zurückführen. Der Ersatz dieses Protons durch Chlor hebt diese Verzerrung auf, und es erscheint ein deutliches Triplett. Die beiden Triplets von **3** erscheinen bei 0,12 ppm (Methylenprotonen benachbart zur Cyangruppe) und 0,45 ppm (Methylenprotonen benachbart zur Aminogruppe) tieferem Feld als diejenigen von **5**. Auch hier wird der eine paramagnetische Verschiebung verursachende Einfluß der zweiten Cyanethylgruppe deutlich. Die größere Tieffeldverschiebung der näher zur Aminogruppe stehenden Methylenprotonen erklärt sich aus der geringeren Entfernung zur zweiten Cyangruppe und dem von ihr ausgehenden (-I)-Effekt. **4** weist demgegenüber 3 Triplets auf, von denen dasjenige bei $\delta = 2,86$ ppm mit dem Integral von 6 Protonen durch die der Cyangruppe benachbarten Methylenprotonen verursacht wird. Das Resonanzsignal bei $\delta = 3,48$ ppm mit dem Integral von 2 Protonen ist den Protonen der sekundären Aminogruppe der benachbarten Methylengruppe zuzuordnen. Die entsprechenden Protonen der der tertiären Aminogruppe benachbarten Methylgruppen bilden das Triplett bei $\delta = 3,86$ ppm mit dem Integral von 4 Protonen. Die Kopplungskonstante der 3 Triplets beträgt $J = 7$ Hz.

Die Protonen der sekundären Aminogruppen von **5** erscheinen bei $\delta = 7,43$ ppm als ein verbreitertes Singulett. Bei 0,29 ppm tieferem Feld tritt das Aminoproton von **4** in Resonanz. Das tripletartige Aussehen des Resonanzsignals läßt auf eine Kopplung mit den Protonen der benachbarten Methylengruppe schließen. Das Integral von **5** entspricht 2 Protonen, das von **4** einem Proton. Alle Aminoprotonen sind austauschbar mit D_2O . An **5** als Prototyp der neu entwickelten Verbindungen sei der massenspektroskopische Abbau dargelegt (Abb. 1). Neben der Fragmentierung der Propylgruppe durch Abspaltung eines Ethylenmoleküls und eines Methylradikals wird durch Verlust eines Cyanmethylradikals aus dem Molekülion das Ion m/e 219 gebildet. Die Spaltung der zur Aminogruppe α,β -ständigen C-3-Bindung ist charakteristisch für aliphatisch substituierte Amine [11]. Die Abspaltung eines Cyanethylradikals führt zum Ion m/e 205 und die Eliminierung von Acrylnitril zum Fragment m/e 206, dessen Bildung sich auf eine McLafferty-Umlagerung zurückführen läßt. Hierbei wandert ein Proton der zur Aminogruppe β -ständigen Methylengruppe nach Ausbildung eines sechsglied-

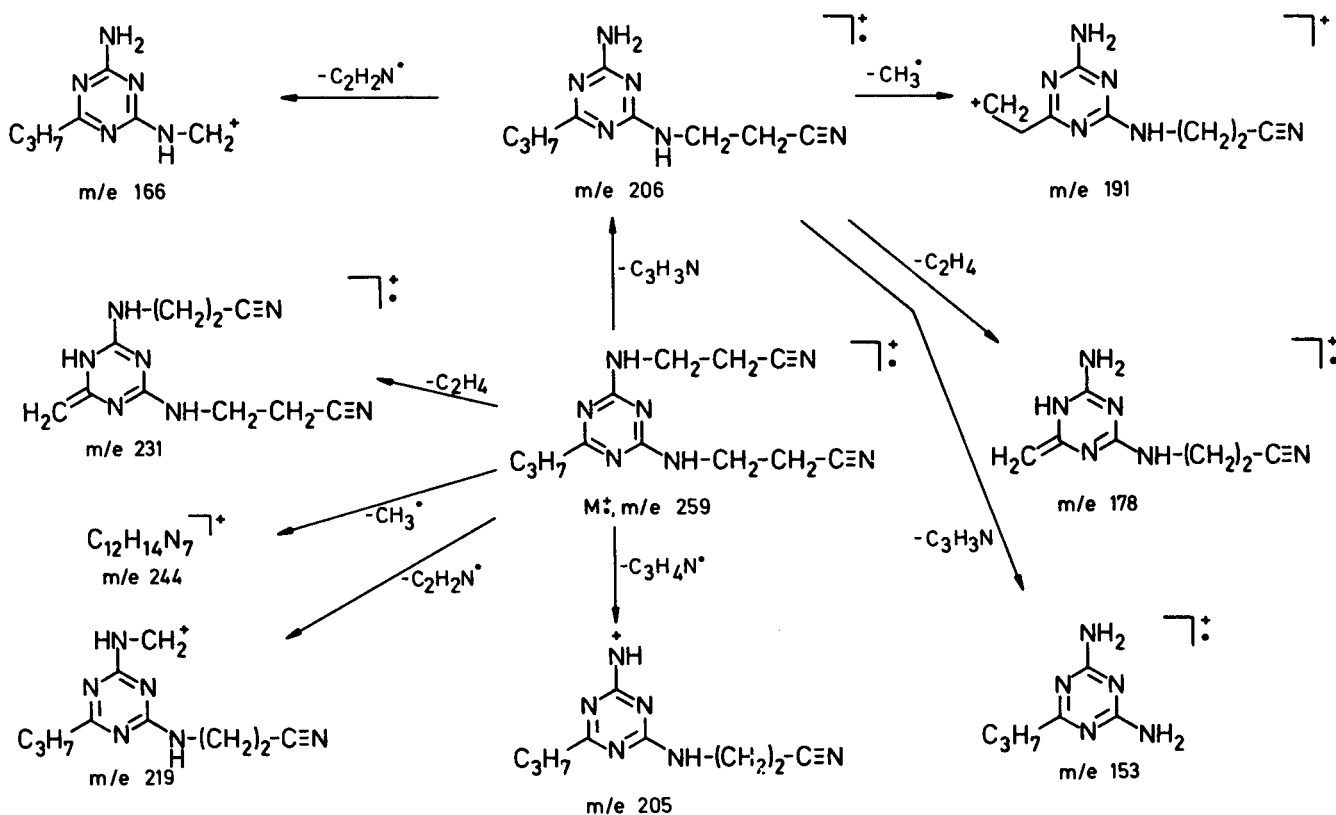


Abbildung 1

rigen Übergangszustandes zum nächstgelegenen Ringstickstoffatom.

Auf die Fragmentierung der Propylgruppe, die unter Abspaltung von Ethylen und eines Methylradikals zu den Ionen m/e 191 und m/e 178 führt, folgt die Eliminierung eines Cyanmethylradikals zum Ion m/e 166. Die Abspaltung von Acrylnitril und einem Cyanethylradikal führt zu dem Fragment m/e 153, dessen bekannte Fragmentierung den unteren Teil des Spektrums bestimmt.

Abb. 1: Massenspektroskopischer Abbau von 2,4-Bis-(2-cyanethylamino)-6-propyl-1,3,5-triazin (5).

In der Prüfung auf Arzneimittelwirkungen stellten sich in der Gruppe der vorliegenden Cyanethylierungsprodukte Vertreter mit antikonvulsiver Wirkung heraus. Am auffallendsten ist diese Wirkung im Fußschocktest an der Maus, indem **4** in der Dosis 30 mg/kg per os einen vor Versuchsbeginn auf 100% festgelegten Krampfkontrollwert um 15% zu erniedrigen vermag. In der gleichen Dosis werden durch **5** neuroleptische Effekte ausgelöst; so erfolgt im Apomorphin-Klettertest Hemmung einer bei Versuchsbeginn auf 100% festgelegten Kontrollaktivität um 28%. Als Iproz. Lösung in der Dosis 10 mg/kg per os appliziert, löst **4** an der Ratte einen cytoprotektiven Effekt gegenüber der Magenschleimhaut aus. Ferner vermag **5**

herbizide Wirksamkeit gegen Monokotyledonen zu entfalten.

Betrachtet man in den Cyanethylierungsprodukten **3-5** als eine markante Partialstruktur den Alkyl-Stickstoffheterocyclus, so ergeben sich hinsichtlich der antikonvulsiven Wirkung aufschlußreiche Parallelen zu Antikonvulsiva mit analogem Strukturanteil, wie Primidon [12], Ethosuximid [13] oder 2-Amino-4-pivaloylamino-6-propyl-1,3,5-triazin [3], das bei der Prüfung auf antikonvulsive Wirkung im Fußschocktest in der Dosis 30 mg/kg per os an der Maus eine Krampfhemmung um 30% auslöst.

Wir danken dem Fonds der Chemischen Industrie, Frankfurt/M., für die Förderung der vorliegenden Untersuchungen durch Bereitstellung von Forschungsmitteln, der SKW Trostberg AG, Trostberg speziell für die Überlassung von Grundchemikalien auf Cyanamidbasis.

EXPERIMENTELLER TEIL

Die Schmelzpunkte wurden in der Schmelzpunktapparatur nach Büchi SMP 20/Dr. Tottoli bestimmt und sind unkorrigiert angegeben. Zur Aufnahme der spektroskopischen Daten wurden die folgenden Geräte verwendet: für die IR-Spektren das Beckman Spektralphotometer IR-33 und IR-4220, für die 1H -NMR-Spektren das Varian-Gerät Em 360 A und Bruker WH 90, TMS als innerer Standard, und für die Massenspektren das Gerät CH 7A Varian MAT Bremen.

2,4-Bis[bis(2-cyanethylamino)-6-propyl-1,3,5-triazin (3).

a) Bei niedriger Konzentration von Kaliumhydroxid.

Verbindung **1** (3,06 g, 20 mmol) und 30 mg fein gepulvertes Kaliumhydroxid werden in 30 ml Acetonitril eingebracht. Zur siedenden Suspension werden unter Rühren 4,25 g (80 mmol) mit 40 ppm Hydrochinonmonomethylether stabilisiertes Acrylnitril (**2**) gegeben. Während des 1,5 stdg. Erhitzens unter Rückfluß entsteht eine gelbe Lösung, die bei Reaktionsende noch etwas durch **1** getrübt ist. Nach dem Absaugen wird das Filtrat i. Vak. eingeeengt und das entstandene dunkelbraune Öl in Aceton unter tropfenweiser Zugabe von Wasser bei -4° zur Kristallisation gebracht. Nach wiederholter Umkristallisation aus Aceton/Wasser resultieren 5,41 g (74% d. Th.) farblose Nadeln vom Schmp. 90° .

b) Bei höherer Konzentration von Kaliumhydroxid.

Zur siedenden Suspension von 3,06 g (20 mmol) **1** und 300 mg fein gepulvertem Kaliumhydroxid in 30 ml Acetonitril werden unter Rühren 4,25 g (80 mmol) mit 40 ppm Hydrochinonmonomethylether stabilisiertes Acrylnitril (**2**) schnell hinzugegeben. Nach 2 minütigem Rühren wird das Reaktionsgemisch abkühlen gelassen und nach a) weiterverarbeitet. Nach der Umkristallisation resultieren 2,56 g (35% d. Th.) farblose Nadeln vom Schmp. 96° ; IR (Kaliumbromid): 2980, 2950, 2880 (CH_3 , CH_2), 2260 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 1560, 1540, 1500, 830 (Triazin $\text{C}=\text{N}$), 1430, 1390, 1375, cm^{-1} (CH_3 , CH_2); $^1\text{H-NMR}$ (D_6 -DMSO): δ (ppm) = 0,9 (t, 3H, $\text{J} = 7$ Hz, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 1,7 (m, 2H, $\text{J} = 7$ Hz, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2$), 2,48 (t, 2H, $\text{J} = 7$ Hz, 6-CH_2), 2,88 (t, 8H, $\text{J} = 7$ Hz, $2,4\text{-N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 3,88 (t, 8H, $\text{J} = 7$ Hz, $2,4\text{-N}(\text{CH}_2)_2$); MS (70 eV): $m/e = 365$ (32% M $^+$), 350 (13%, M- CH_3), 337 (50%, M- C_2H_4), 325 (65%, M- $\text{C}_2\text{H}_2\text{N}$), 312 (10%, M- $\text{C}_2\text{H}_3\text{N}$), 311 (35%, M- $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}$), 297 (8%, 312-CH_3), 284 (9%, $312\text{-C}_2\text{H}_4$), 272 (100%, $312\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 259 (2%, $312\text{-C}_3\text{H}_3\text{N}$), 258 (3%, $312\text{-C}_3\text{H}_4\text{N}$), 244 (15%, 259-CH_3), 231 (15%, 259-CH_3), 231 (15%, $259\text{-C}_2\text{H}_4$), 219 (8%, $259\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 206 (7%, M- $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}$), 205 (3%, M- $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}$), 191 (19%, 206-CH_3), 178 (18%, $206\text{-C}_2\text{H}_4$), 166 (4%, $206\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 153 (3%, $206\text{-C}_3\text{H}_3\text{N}$), 152 (1%, M- $\text{C}_3\text{H}_2\text{N}$), 69 (5%, $\text{C}_2\text{H}_3\text{N}_3^+$), 68 (30%, $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}_2^+$).

Anal. Ber. für $\text{C}_{18}\text{H}_{28}\text{N}_8$ (365,4): C, 59,2; H, 6,34; N, 34,5. Gef.: C, 59,2; H, 6,34; N, 34,3.

2-Bis(2-cyanethylamino)-4-(2-cyanethylamino)-6-propyl-1,3,5-triazine (4).

Der Ansatz nach b) wird 20 Minuten unter Rückfluß gerührt. Die durch **1** getrübe, gelbe Lösung wird analog a) weiterverarbeitet. Es resultieren 2,85 g (55% d. Th.) farblose Nadeln vom Schmp. 130° ; IR (Kaliumbromid): 3260, 3170, 3140, 3100 (NH), 2980, 2880 (CH_3 , CH_2), 2260 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 1605 (NH), 1565, 1545, 1515, 830 (Triazin $\text{C}=\text{N}$), 1445, 1420, 1375 cm^{-1} (CH_3 , CH_2); $^1\text{H-NMR}$ (D_6 -DMSO): δ (ppm) = 0,93 (t, 3H, $\text{J} = 7$ Hz, $6\text{-}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$), 1,7 (m, 2H, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2$), 2,46 (t, 2H, $\text{J} = 7$ Hz, 6-CH_2), 2,86 (t, 6H, $\text{J} = 7$ Hz, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2$) und $4\text{-NH}(\text{CH}_2\text{CH}_2)$, 3,48 (t, 2H, $\text{J} = 7$ Hz, 4-NHCH_2), 3,86 (t, 4H, $\text{J} = 7$ Hz, $2\text{-N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 7,72 (s*, 1H, 4-NH); MS (70 eV) $m/e = 312$ (28%, M $^+$), 297 (26%, M- CH_3), 284 (100%, M- C_2H_4), 272 (57%, M- $\text{C}_2\text{H}_2\text{N}$), 259 (12%, M- $\text{C}_3\text{H}_3\text{N}$), 258 (26%, M- $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}$), 244 (24%, 259-CH_3), 231 (83%, $259\text{-C}_2\text{H}_4$), 219 (83%, $259\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 206 (3%, $259\text{-C}_3\text{H}_3\text{N}$), 205 (3%, $259\text{-C}_3\text{H}_4\text{N}$), 191 (21%, 206-CH_3), 178 (13%, $206\text{-C}_2\text{H}_4$), 166 (10%, $206\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 153 (2%, $206\text{-C}_3\text{H}_3\text{N}$), 152 (2%, $206\text{-C}_3\text{H}_2\text{N}$), 138 (4%, 153-CH_3), 125 (7%, $153\text{-C}_2\text{H}_4$), 111 (2%, $153\text{-H}_2\text{NCN}$), 98 (1%, 125-HCN), 83 (13%, $125\text{-H}_2\text{NCN}$), 69 (9%, $\text{C}_2\text{H}_3\text{N}_3^+$), 68 (43%, $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}_2^+$).

Anal. Ber. für $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{N}_8$ (312,4): C, 57,7; H, 6,45; N, 35,9. Gef.: C, 57,8; H, 6,59; N, 35,9.

2,4-Bis(2-cyanethylamino)-propyl-1,3,5-triazin (5).

Den nach b) vorbereiteten Ansatz von **4** läßt man 1,5 h unter Rückfluß rühren und arbeitet das resultierende braune Öl nach b) auf. Man erhält 3,47 g (67%, d. Th.) farblose Nadeln vom Schmp. 153° ; IR (Kaliumbromid): 3260, 3120 (NH), 2965, 2880 (CH_3 , CH_2), 2260 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 1625 (NH), 1545, 830 (Triazin $\text{C}=\text{N}$), 1470, 1460, 1445, 1430, 1385 cm^{-1} (CH_2CH_2); $^1\text{H-NMR}$ (D_6 -DMSO): δ (ppm) = 0,9 (t, 3H, $\text{J} = 7$ Hz, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 1,7 (m, 2H, $6\text{-CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 2,38 (t, 2H, $\text{J} = 7$ Hz, 6-CH_2), 2,76 (t, 4H, $\text{J} = 7$ Hz, $2,4\text{-NHCH}_2\text{CH}_2$), 3,43 (t, 4H, $2,4\text{-NHCH}_2$), 7,43 (s*, 2H, 2,4-NH), *breit, austaschbar mit D_2O ; MS: (70 eV) $m/e = 259$ (15%, M $^+$), 244 (29%, M- CH_3), 231 (100%, M- C_2H_4), 219 (13%, M- $\text{C}_2\text{H}_2\text{N}$), 206 (7%, M- $\text{C}_3\text{H}_3\text{N}$), 205 (3%, M- $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}$), 191 (19%, 206-CH_3), 178 (18%, $206\text{-C}_2\text{H}_4$), 166 (4%, $206\text{-C}_2\text{H}_2\text{N}$), 153 (3%, $206\text{-C}_3\text{H}_3\text{N}$), 152 (1%, M- $\text{C}_3\text{H}_2\text{N}$), 138 (7%, 153-CH_3), 125 (15%, $153\text{-C}_2\text{H}_4$), 111 (2%, $153\text{-H}_2\text{NCN}$), 83 (2%, $125\text{-H}_2\text{NCN}$), 69 (7%, $\text{C}_2\text{H}_3\text{N}_3^+$), 68 (24%, $\text{C}_3\text{H}_4\text{N}_2^+$).

Anal. Ber. für $\text{C}_{12}\text{H}_{17}\text{N}_7$ (259,3): C, 55,6; H, 6,61; N, 37,8. Gef.: C, 55,4; H, 6,48; N, 37,7.

LITERATUR UND FUßNOTEN

** Als Teil eines Referats vorgetragen im Wissenschaftlichen Kolloquium der Faculté de pharmacie, Université de Montréal, Montréal, Québec, Kanada, September 1985.

*** Aus der Dissertation M. Loch, Universität Mainz, 1985.

[1] I. Mitt.: A. Kreutzberger und M. Loch, *Arch. Pharm.* (Weinheim), **319**, 769 (1986).

[2] L. A. Suranyi, *Mitt. Dtsch. Pharm. Ges.*, **39**, 73 (1969).

[3] A. Kreutzberger und M. Loch, *Arch. Pharm.* (Weinheim), im Druck.

[4] A. Kreutzberger und U. Rose, *Arch. Pharm.* (Weinheim), **317**, 1048 (1984).

[5] A. Kreutzberger und U. Rose, *J. Fluorine Chem.*, **30**, 329 (1985).

[6] M. A. Spielman, und G. M. Everett, *J. Am. Chem. Soc.*, **70**, 1021 (1948).

[7] L. L. McKinney, E. H. Uhing, E. A. Setzkorn und J. C. Cowan, *J. Am. Chem. Soc.*, **73**, 1641 (1951).

[8] L. L. McKinney, E. A. Setzkorn und E. H. Uhing, *J. Am. Chem. Soc.*, **74**, 1942 (1952).

[9] R. A. Russell und H. W. Thompson, *J. Chem. Soc.*, 483 (1955).

[10] B. Witkop und J. B. Patrick, *J. Am. Chem. Soc.*, **73**, 2188 (1951).

[11] G. Spittler, "Massenspektrometrische Strukturanalyse organischer Verbindungen", Verlag Chemie GmbH, Weinheim/Bergstraße, 1966, S. 116.

[12] I. Y. Bogue und H. C. Carrington, *Britt. J. Pharmacol. Chemother.*, **8**, 230 (1953).

[13] G. Chen, R. Portman, C. Esow und A. C. Bratton, Jr., *J. Pharmacol. Exp. Ther.*, **103**, 54 (1951).

English Summary.

The cyanoethylation of butyroguanamine (**1**) comprising the addition of acrylonitrile (**2**) leads to the cyanoethylated propyl-1,3,5-triazines **3**, **4**, and **5**. The sharp band of the $\text{C}\equiv\text{N}$ stretching vibrations at 2260 cm^{-1} in the ir spectra is very characteristic for these structures. In the mass spectra, cleavage of a cyanoethyl radical is shown to be a marked degradation path. While **4** is capable of producing anticonvulsive and cytoprotective effects, **5** exhibits neuroleptic and herbicidal activity.