

СИНТЕЗ 1,4,5-ТРИЗАМЕЩЕННЫХ 1,2,3-ТРИАЗОЛОВ НА ОСНОВЕ 2-АРИЛАМИНО-4-АМИНО-5-ЭТОКСИКАРБОНИЛ-1,3-ТИАЗОЛОВ

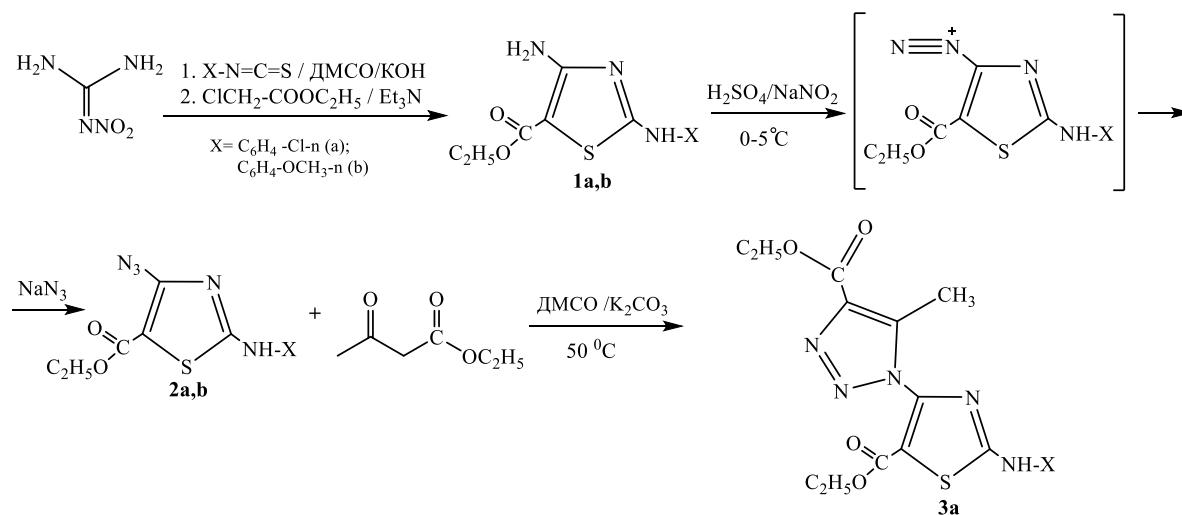
Гайковская Е. М., Ковалева О. А., Ефимова Т. П., Новикова Т. А.

Российский государственный педагогический университет им. А. И. Герцена

E-mail: kohrgpu@yandex.ru

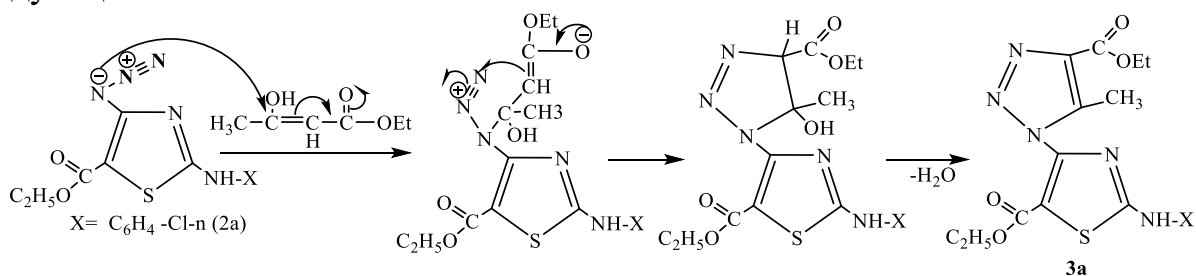
Функционально замещенные 1,2,3-триазолы нашли широкое применение в медицине, производстве материалов и синтетической органической химии [1]. Наиболее широко используемый метод их синтеза основан на 1,3-диполярном циклоприсоединении азидов к ацетиленовым производным (реакция Хьюсена). Реакция Хьюсена протекает региоспецифично и приводит к образованию дизамещенного 1,2,3-триазола. Синтез тризамещенных 1,2,3-триазолов также может быть осуществлен по пути [3+2]-циклоприсоединения между азидами и СН-кислотами. Высокая региоспецифичность, экспериментальная простота и доступность этих реакций определяет актуальность их изучения и применения для синтеза 1,4,5-тризамещенных 1,2,3-триазолов [1].

Нами 1,4,5-тризамещенный 1,2,3-триазол **3a** был получен на основе 2-ариламино-4-амино-5-этоксикарбонил-1,3-тиазола **1a**, который в свою очередь был синтезирован трехкомпонентным one-pot методом в результате взаимодействия 2-нитрогуанидина, 4-хлорфенилизотиоционата и этилового эфира хлоруксусной кислоты с выходом 75%.

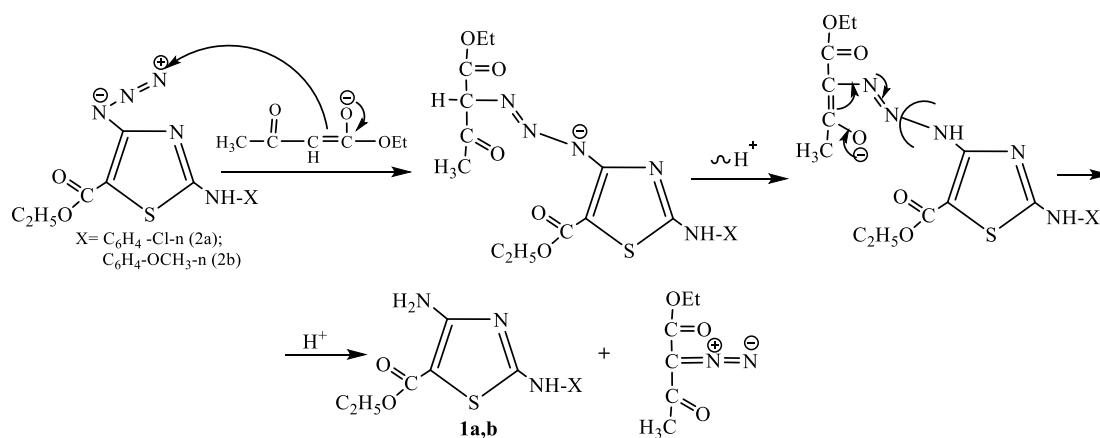


2-Ариламино-4-амино-5-этоксикарбонил-1,3-тиазолы **1a,b** диазотировали 70% серной кислотой с нитритом натрия с последующим нуклеофильным замещением азидом натрия, что позволило выделить 2-ариламино-4-азидо-5-этоксикарбонил-1,3-тиазолы **2a,b** с выходами до 86%. Полученные гетероциклические азиды **2a,b** вводили в реакцию 1,3-диполярного циклоприсоединения с ацетоуксусным эфиром. Данную реакцию можно

отнести к так называемым клик-реакциям, которые в последнее время широко изучаются. В литературе обсуждаются механизмы подобных реакций и отмечается их чувствительность к условиям проведения [1–3]. При осуществлении реакции в ДМСО в присутствии карбоната калия при 50 °С нами было выделено с выходом 64% кристаллическое вещество — 1,4,5-тризамещенный 1,2,3-триазол **3a**, образование которого можно представить следующей схемой:



Нами отмечается, что повышение температуры реакции до 70 °С приводит к выделению смеси, состоящей из 1,4,5-тризамещенных 1,2,3-триазолов **3a,b** и исходных 2-ариламино-4-амино-5-этоксикарбонил-1,3-тиазолов **1a,b**, образование которых можно объяснить развитием еще одного направления реакции, в результате которого происходит диазоперенос на ацетоуксусный эфир, что можно объяснить следующим механизмом:



Строение полученных соединений **1a,b-3a,b** подтверждено методами ИК, ЯМР ^1H , ^{13}C спектроскопии с привлечением двумерных гетероядерных (НМРС, НМВС) экспериментов.

Список литературы

- Ziqiang Y., Yuanheng L., Mingming M. // *Org. Lett.* 2019. Vol. 21. N. 18. P. 7204.
- Golobokova T.V., Proidakova A.G., Kizhnyaev V.N. // *Russ. J. Org. Chem.* 2020. Vol. 56. N. 3. P. 442.
- Mamedov V.A., Valeeva V.N., Antokhina L.A., Doroshkina G.M., Chernova A.V., Nuretdinov I.A. // *Chem. Heterocyclic Comp.* 1993. Vol. 29. N. 5. P. 607.