

СИНТЕЗ 2-АМІНО-5-АЛКІЛ-1,3-ОКСАЗОЛІВ

Виконано дослідження синтезу 2-аміно-5-алкіл-1,3-оксазолів шляхом внутрішньомолекулярної модифікації 3-N-ацилпохідних-5-алкіл-1,2-оксазолів.

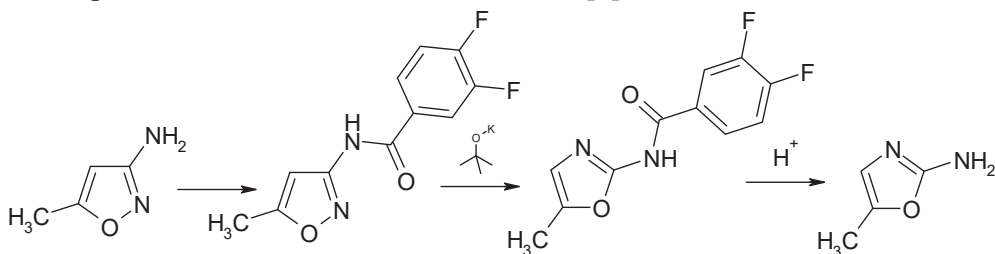
The study of the synthesis of 2-amino-5-alkyl-1,3-oxazoles by intramolecular modification of 3-N-acyl derivatives-5-alkyl-1,2-oxazoles was carried out.

Ключові слова: 2-аміно-5-алкіл-1,3-оксазол, алкілпохідні

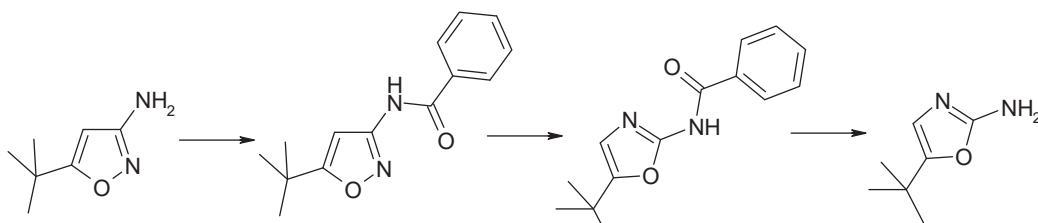
Серед 2-аміно-1,3-оксазолів відомо чимало сполук, які характеризуються різними видами біологічної активності [1,2].

Очевидно, що оптимізація шляхів отримання подібних похідних є в наш час актуальним завданням для науковців. У більшості публікацій приділяється увага пошуку шляхів отримання оксазолів з ароматичними та гетероциклічними фрагментами, для алкілпохідних цього ряду представлено лише декілька прикладів синтезу.

Один із варіантів отримання 2-аміно-5-алкіл-1,3-оксазолів – метод на основі модифікації 3-аміно-5-алкіл-1,2-оксазолів [3].



У ході дослідження ми певним чином трансформували представлений у літературних джерелах метод і здійснили перетворення згідно наступної схеми.

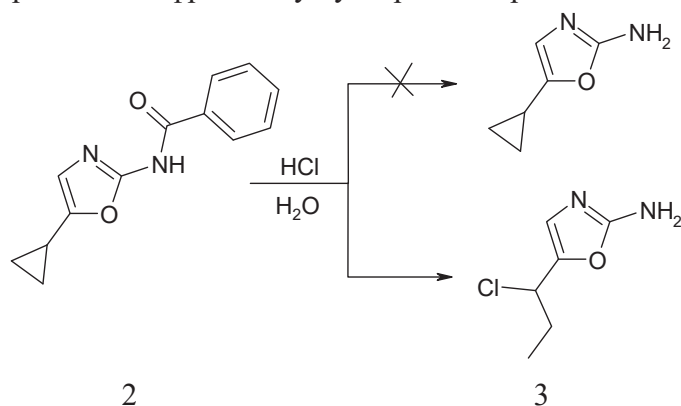


1

Таким чином з виходом 74% на останній стадії було виділено 2-аміно-5-*трет*бутил-1,3-оксазол 1.

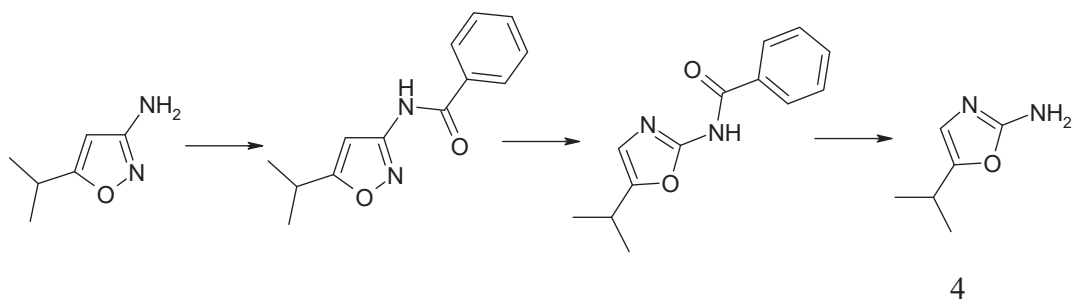
Спектральний аналіз показав, що у спектрі ПМР виділеної сполуки 1 наявні сигнали у вигляді синглетів, що характерні для залишку третбутилового фрагменту (1,2 м.ч.), аміногрупи (6,3 м.ч.) та атома Гідрогену у четвертому положенні оксазольного циклу (6.2 м.ч.).

У той же час, при спробі подібним шляхом отримати 2-аміно-5-циклопропіл-1,3-оксазол ми зіткнулися з проблемою на останній стадії. При кип'ятінні у хлоридній кислоті сполуки 2 відбувається не лише гідроліз амідного зв'язку, а і взаємодія циклопропанового фрагменту з гідроген хлоридом. Згідно з результатами аналітичного контролю (ПМР, хромато-мас-аналіз) нам вдалося з'ясувати, що відбувається приєднання HCl до залишку циклопропану з утворенням *n*-пропільного фрагменту і утворюється речовина 3.



Виділити продукт приєднання хлороводню 3 у індивідуальному вигляді не вдалося, проте у спектрі ПМР наявні сигнали у області аліфатичних протонів, що вказують на розкриття циклопропанового циклу.

Певні складнощі виникли і при синтезі оксазолу 4, що містить ізопропільний фрагмент у п'ятому положенні гетероцикла.



Було з'ясовано, що остання стадія у даному випадку не відбувається гладко, кінцева сполука була виділена у вигляді маслоподібного осаду з низьким виходом. Шляхом хроматографічної очистки вдалося виділити цільовий продукт 4, однак виявилось, що ця сполука починає розкладатися протягом кількох днів.

Таким чином, пошук нових актуальних підходів для синтезу 2-амінооксазолів, що містять алкільний залишок у 5-положенні гетероциклічного ядра є актуальним і надалі.

Дослідження були виконані з використанням потужностей ТОВ НВК «Укроргсинтез».

Список використаних джерел

1. Molly A., Silvers G. T., Robertson C. M., Taylor G. L., Waldrop J. Design, synthesis, and antibacterial properties of dual-ligand inhibitors of acetyl-CoA carboxylase. *Journal of Medicinal Chemistry*. 2014. Vol. 57. № 21. P. 8947–8959.
2. Vieira E., Huwyler J., Jolidon S., Knoflach F. Fluorinated 9H-xanthene-9-carboxylic acid oxazol-2-ylamides as potent, orally available mGlu1 receptor enhancers. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*. 2009. № 19. P. 1666–1669.
3. Perez J., Diaz R., Yranzo G. Gas-phase thermal isomerization of some aminomethyisoxazoles. *Journal of Organic Chemistry*. 1981. № 46. P. 3505–3508.

УДК 547.32+547.556.7

**Заболотна М.В., Драбик М.Р., Голодюк І.М.,
Тулайдан Г.М., Симчак Р.В., Барановський В.С.**

*Тернопільський національний педагогічний університет
імені Володимира Гнатюка*

ГАЛОГЕН- І ТІОЦІАНАТОАРИЛЮВАННЯ МОНОАЛІЛОВОГО ЕТЕРУ ГЛІЦЕРИНУ

Досліджено купрокаталітичну взаємодію арилдіазоній хлоридів і тетрафлуороборатів з моноаліловим етером гліцерину в умовах реакцій Меєрвейна і аніонарилювання та з'ясовано основні фактори хемоселективності даних реакцій. Розроблено методики синтезу 3-(3-арил-2-хлоро(тіоціанато)пропокси)пропан-1,2-діолів та встановлено основні фізико-хімічні константи і спектральні характеристики синтезованих сполук.

The copper-catalytic interaction of aryldiazonium chlorides and tetrafluoroborates with glycerol monoallyl ether under the conditions of Meerwein and anionarylation reactions was investigated and the main factors of the chemoselectivity of these reactions were clarified. Methods for the synthesis of 3-(3-aryl-2-chloro(thiocyanato)propoxy) propane-1,2-diols were developed and the main physicochemical constants and spectral characteristics of the synthesized compounds were determined.

Ключові слова: хлориди і тетрафлуороборати арилдіазонію, аніонарилювання, моноаліловий етер гліцерину, 3-(3-арил-2-хлоро(тіоціанато)пропокси)пропан-1,2-діоли.