

## СИНТЕЗ 2-АМІНО-4-АРИЛ-1,3-ОКСАЗОЛІВ

Третяк Іван Юрійович

Студент

Макей Олександр Павлович

Викладач

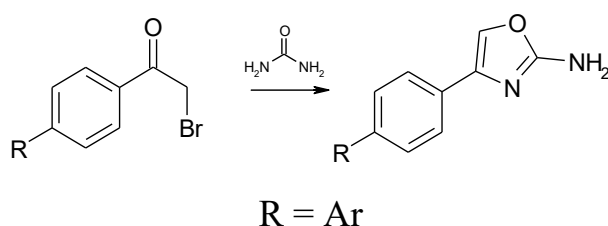
Національний університет «Чернігівський колегіум»

імені Т. Г. Шевченка

м. Чернігів, Україна

**Вступ.** Серед похідних амінооксазолів є чимало сполук, що характеризуються різними видами біологічної активності. Зокрема, зустрічаються сполуки, яким притаманна противірусна та протипухлинна активність. Також наявні відомі антидепресанти, психостимулятори, регулятори апетиту.

Один із найбільш популярних методів синтезу 4-арил-2-амінооксазолів є взаємодія відповідних галогенкетонів з карбамідом (рис. 1).



**Рис. 1. Схема синтезу на основі сечовини**

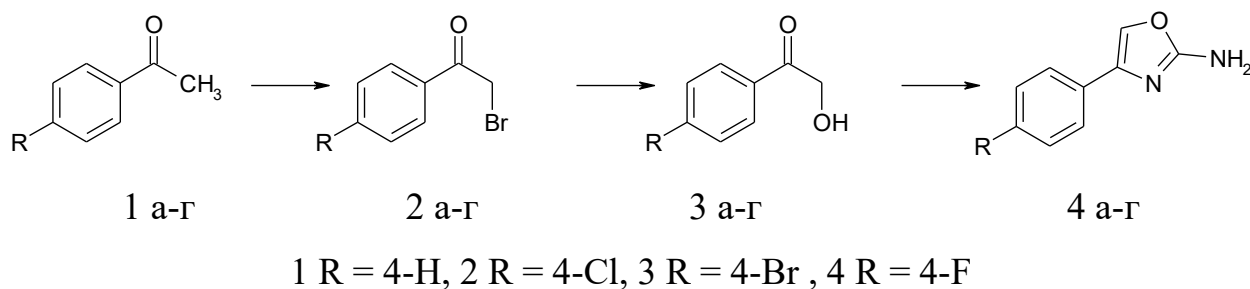
Проте, вказане перетворення відбувається найчастіше за високих температур та нерідко супроводжується невисокими виходами кінцевих продуктів внаслідок утворення значних кількостей побічних речовин.

**Мета роботи.** Встановлення закономірностей перебігу реакцій синтезу 4-арил-2-амінооксазолів і виявлення оптимальних умов отримання досліджуваних сполук.

**Матеріали та методи.** Органічний синтез, метод ядерного магнітного резонансу, метод рідинної хроматографії.

**Результати та обговорення.** Нами в ході досліджень був апробований шлях, в якому амінооксазоли 4а-г були отримані при взаємодії кетоспиртів 3а-г

з ціанамідом (рис. 2).

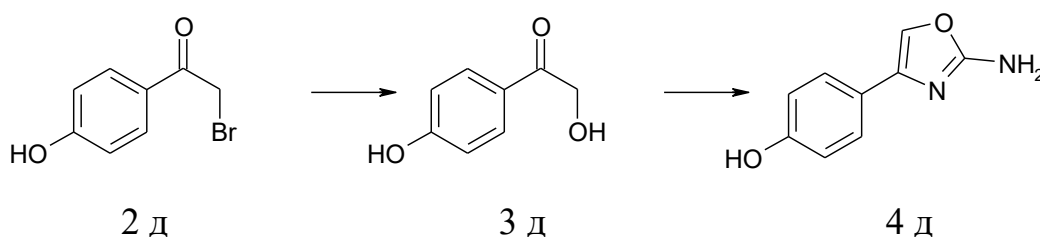


**Рис. 2. Схема синтезу на основі кетоспиртів**

Згідно запропонованої схеми галогенкетони 2а-г були перетворені на кетоспирти 3а-г з виходами 70-80 %. На останній стадії сполуки 4а-г були отримані з виходами 37-63 % у досить м'яких умовах і фактично не потребували додаткової очистки.

У спектрах ПМР отриманих сполук 4а-г, виміряних у ДМСО-d<sub>6</sub>, має місце синглет 2-аміногрупи при 6,6-6,8 м.ч. та сигнал 5-Н протону оксазольного ядра при 8,0 м.ч, що відповідає запропонованій структурі. Інші протони ароматичного залишку у четвертому положенні оксазола резонують у характерних для них областях.

Однак, при спробі синтезу сполуки 4д (рис. 3), виникли певні ускладнення.



**Рис. 3. Схема синтезу 4-(2-аміно-1,3-оксазол-4-іл)фенолу**

Зокрема, в умовах, аналогічних для отримання похідних 4а-г, за даними LCMS вміст бажаного амінооксазола 4д у суміші після проведення хімічного перетворення на останній стадії було зафіксовано лише в межах 3-5%. Також суттєвого впливу на хід реакції не виявлено від дії температури та часу проведення процесу.

Певним чином на перебіг вплинув характер основи, що додається до реакційної суміші. А саме, при використанні насиченого розчину амоніаку у метанолі вдалося підвищити ступінь перетворення в реакції до 27%. Однак виділити сполуку 4д в індивідуальному вигляді не вдалося.

**Висновки.** Таким чином запропонований шлях перетворення ароматичних кетонів 1а-г у 4-амінооксазоли 4а-г може бути перспективний у подальших дослідженнях.