

R-169

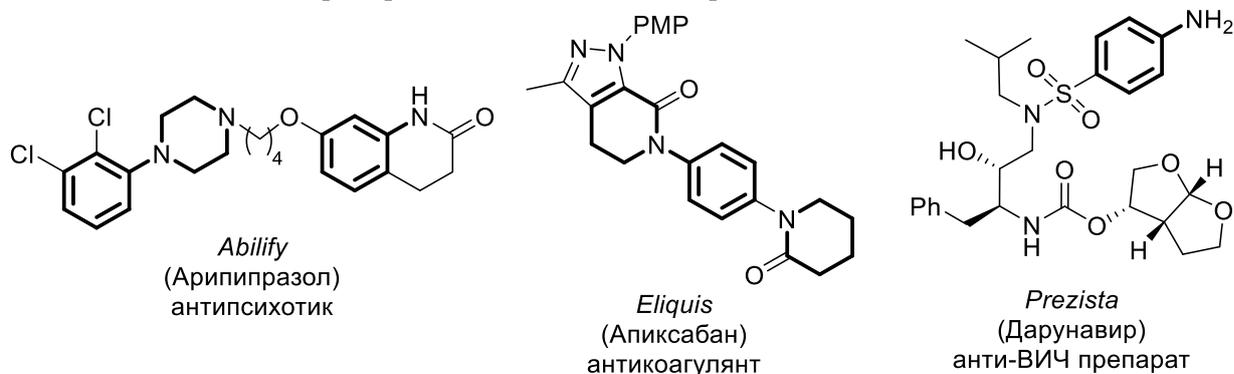
**РЕАКЦИЯ НУКЛЕОФИЛЬНОГО ЗАМЕЩЕНИЯ ВОДОРОДА
В 1,2,4-ТРИАЗИНАХ ПОД ДЕЙСТВИЕМ АНИЛИНОВ**

А. Д. Шарапов, Р. Ф. Фатыхов, И. А. Халымбаджа, А. П. Потапова, Е. М. Гурина

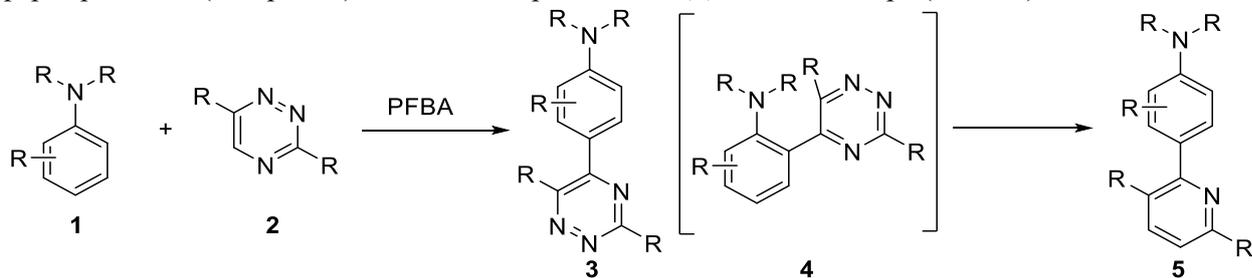
Уральский федеральный университет, 620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19

E-mail: a.d.sharapov@urfu.ru

Ариламины составляют основную структуру многих терапевтических средств, агрохимикатов и органических материалов (схема 1). Разработка методов эффективного и избирательного конструирования этих структурных мотивов из простых строительных блоков по-прежнему востребована. Синтез орто- и пара-замещенных анилинов с использованием известных методов введения (гетеро)ароматических фрагментов также имеет свои недостатки, связанные с использованием дорогостоящих катализаторов и многостадийных процессов. По существу, методы прямого СН/СН сочетания нефункционализированных ариламинов имеют стратегическое направление в развитии технологии органического синтеза. Поэтому целью данной работы является разработка эффективных методов СН/СН сочетания на примере взаимодействия 1,2,4-триазинов с анилинами.



В представленной работе предложен одностадийный и эффективный подход в синтезе орто- и пара-(1,2,4-триазинил)анилинов **3,4** из анилинов **1** и 1,2,4-триазинов **2**. Было установлено, что монозамещенные 1,2,4-триазиниланилины могут быть получены в условиях кислотной активации перфторбутановой кислотой (от 1 до 3 экв.) в микроволновом синтезе при 90 °С в течение 1 часа. Другие условия кислотной активации в условиях сильных кислот (MsOH, H₂SO₄) не приводили к целевым продуктам. В случае применения фосфорной и муравьиной кислот выходы конечных продуктов не были выше 50%. Таким образом, преимуществами данной реакции СН/СН функционализации анилинов следует считать одностадийность, отказ от использования металлических катализаторов, высокие выходы, региоселективность процесса. Кроме того, (1,2,4-триазинил)анилины **3** могут быть легко трансформированы в (2-пиридил)анилины **5** по реакции аза-Дильса – Альдера (схема 2).



Работа выполнена при финансовой поддержке, проект РНФ № 23-73-10050.