

1. Darbarwar, M.; Sundaramurthy, V. Synthesis of Coumarins with 3:4-Fused Ring Systems and their Physiological Activity // *Synthesis* 1982, P. 337–388.

2. A. Pace, P. Pierro, S. Buscemi, N. Vivona and G. Barone. Experimental and DFT Studies on Competitive Heterocyclic Rearrangements. A Cascade Isoxazole–1,2,4-Oxadiazole–Oxazole Rearrangement // *J. Org. Chem.*, 2009, V. 74, P. 351-358.

3. V. Ya. Sosnovskikh, V. S. Moshkin, M. Yu. Kornev and M. I. Koss. Reactions of 3-aminoisoxazolo[4,5-*c*]coumarin with benzoyl chloride: the first example of a preparative 1,2,4-oxadiazole–oxazole rearrangement // *Mendeleev Commun.*, 2011. V. 21, P. 110-111.

## СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 5-(2-(ТРИФТОРМЕТИЛ)-1H-ИНДОЛ-3-ИЛ)-1H-ПИРАЗОЛ-3-КАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ РЕАКЦИЕЙ ФИШЕРА

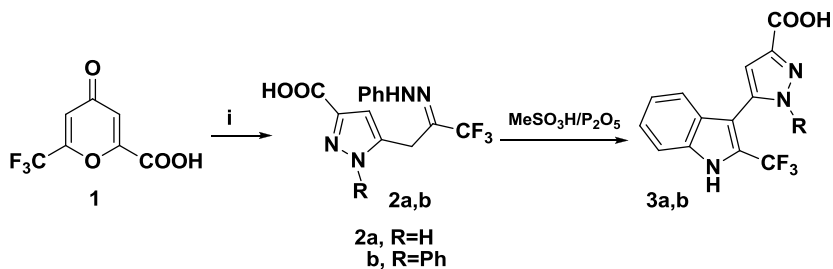
*Котович И.В., Обыденнов Д.Л., Усачев Б.И., Сосновских В.Я.*

Уральский государственный университет  
620000, г. Екатеринбург, пр. Ленина, д. 51

Замещенные 2-(трифторметил)индолы – труднодоступные соединения с высокой биологической активностью [1], поэтому их синтез является актуальной задачей.

Известно [2], что 6-(трифторметил)комановая кислота **1a** и ее производные являются важными синтонами для получения разнообразных фторсодержащих гетероциклических систем, поэтому нами была изучена возможность фенилгидразонов **2a,b**, продуктов взаимодействия кислоты **1a** с гидразинами, вступать в реакцию Фишера. Оказалось, что фенилгидразоны **2a,b** при кипячении в AcOH с добавлением HCl или CH<sub>3</sub>SO<sub>3</sub>H дают соответствующие индолы **3a,b** в следовых количествах. При проведении данной реакции в CH<sub>3</sub>SO<sub>3</sub>H с добавлением P<sub>2</sub>O<sub>5</sub> можно получить 2-(трифторметил)индолы **3a,b** с выходами порядка 40%. В результате опытов были установлены оптимальная концентрация P<sub>2</sub>O<sub>5</sub>, равная 15%, и температура проведения реакции, равная 50 °С.

Таким образом, в данной работе были подобраны оптимальные условия проведения реакции Фишера для фенилгидразонов **2a,b** и синтезированы новые производные 5-(2-(трифторметил)-1H-индол-3-ил)-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты **3a,b**.



i: **R=H**, a)  $\text{N}_2\text{H}_4 \cdot 2\text{HCl}$ ; b)  $\text{PhNHNH}_2 \cdot \text{HCl}$   
**R=Ph**,  $\text{PhNHNH}_2 \cdot \text{HCl}$

1. Yu Chen, Yuji Wang, Zheming Sun, Dawei Ma Elaboration of 2-(trifluoromethyl)indoles via a cascade coupling/condensation/ deacylation process // *Organic Letters*. 2008. V. 10. N 4. P. 625-628.

2. Usachev B.I., Obydenov D.L., Kodess M.I., Sosnovskikh V. Ya. Regioselective solvent-sensitive reactions of 6-(trifluoromethyl)comanic acid and its derivatives with phenylhydrazine // *Tetrahedron letters*. 2009. V. 50. N 31. P. 4446-4448.

## СИНТЕЗ АЗОЛО[1,2,4,5]ТЕТРАЗИНОВ И ИХ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С С-НУКЛЕОФИЛАМИ

Коротина А.В.<sup>(1)</sup>, Толщина С.Г.<sup>(2)</sup>, Игнатенко Н.К.<sup>(2)</sup>, Ишиметова Р.И.<sup>(2)</sup>,  
 Ганебных И.Н.<sup>(2)</sup>, Русинов Г.Л.<sup>(2)</sup>

<sup>(1)</sup>Уральский государственный университет  
 620000, г. Екатеринбург, пр. Ленина, д. 51

<sup>(2)</sup>Институт органического синтеза УрО РАН  
 620041, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22/ Академическая, д. 20

Азолоаннелированные тетразины являются аналогами природных азотистых оснований и представляют интерес как биологически активные соединения. Химия азолотетразинов в настоящее время остается малоизученной областью, поэтому создание новых методов их синтеза и модификации является актуальной задачей.

С целью исследования реакционной способности азолотетразинов в реакциях с нуклеофилами синтезированы новые производные триазоло[4,3-*b*]-, тетразоло[1,5-*b*]-s-тетразинов. Разработан новый метод синтеза имидазо[1,2-*b*]-s-тетразинов, не содержащих заместителей в 6 и 7 положениях, впервые изучена их модификация в реакциях  $\text{S}_\text{N}^\text{H}$ .