

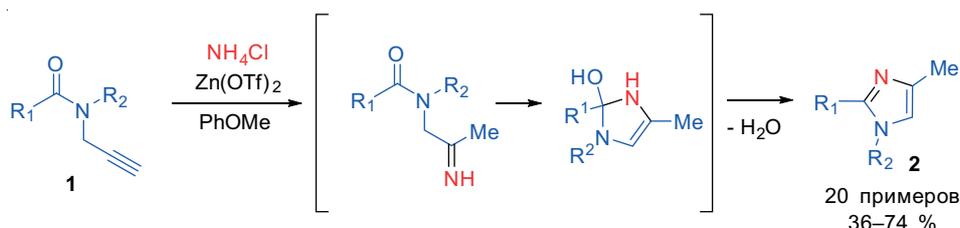
СД-26. СИНТЕЗ 1,2,4-ТРИЗАМЕЩЕННЫХ ИМИДАЗОЛОВ НА ОСНОВЕ ТРЕТИЧНЫХ *N*-ПРОПАРГИЛАМИДОВ

А. В. Сафрыгин, Е. А. Кривошеева, Д. В. Дарьин, М. Ю. Красавин

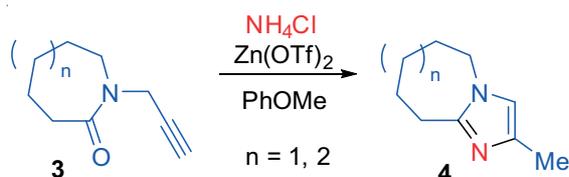
Санкт-Петербургский государственный университет, Институт химии,
198504, Россия, Санкт-Петербург, Петергоф, Университетский пр., 26

E-mail: SafryginAV@yandex.ru

Нами был разработан простой и эффективный метод синтеза 1,2,4-тризамещенных имидазолов **2**, **4** из третичных *N*-пропаргиламида **1** [1]. Реакция предположительно протекает через стадию гидроаминирования с последующей циклизацией и дегидратацией. Условия синтеза были исследованы на разных растворителях, реагентах и катализаторах. Показано, что лучше всего реакция протекает в анизоле в присутствии трифлата цинка. Важной особенностью является то, что аммиак вводится в реакцию в виде хлорида аммония, что позволяет проводить синтез при обычном нагревании на масляной бане без использования сложных установок с автоклавом.



Всего было получено 20 примеров с выходами от высоких до умеренных. При этом показано, что реакция успешно протекает на субстратах с различными заместителями, что позволяет широко варьировать структуру получаемых имидазолов. Стоит отметить, что в исследованную реакцию также вступают циклические амиды – *N*-пропаргиллактамы **3**, что еще раз подтверждает ее широкое применение в синтезе имидазолов.



Полученные имидазолы являются перспективными объектами для биологических исследований, а разработанный подход к их синтезу открывает новый путь создания соединений, содержащих имидазольный фрагмент.

Библиографические ссылки

1. Efficient Conversion of Tertiary Propargylamides into Imidazoles via Hydroamination – Cyclization / A. Safrygin [et al.] // Synthesis (Stuttg). Georg Thieme Verlag. 2018. Vol. 50, № 15. P. 3048–3058.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (проект № 14-50-00069), программы поддержки постдоков СПбГУ.

Исследования проведены с использованием оборудования лабораторий ресурсного центра Научного парка СПбГУ «Магнитно-резонансные методы исследования» и «Методы анализа состава вещества».