

## DR-38

СИНТЕЗ И ПЕРЕГРУППИРОВКА *N*-ОКСИДОВ ОКСАЗОЛОВ

А. Г. Подрезова, А. В. Кутасевич, В. С. Митянов

Российский химико-технологический университет им. Д. И. Менделеева  
125047, г. Москва, Миусская площадь, 9  
E-mail: alexandra.podrezova@mail.ru

*N*-оксиды оксазолов вызывают большой интерес в связи с их широким применением в качестве ценных «билдинг-блоков» в синтезе.

Уникальным проявлением реакционной способности *N*-оксидов оксазолов является их перегруппировка в 4-хлорметильные производные под действием POCl<sub>3</sub>.<sup>[1]</sup> Получаемые этим методом 4-хлорметил-2-арилорксазолы послужили основой для синтеза широкого ряда производных, проявляющих разнообразную биологическую активность.<sup>[2,3]</sup>

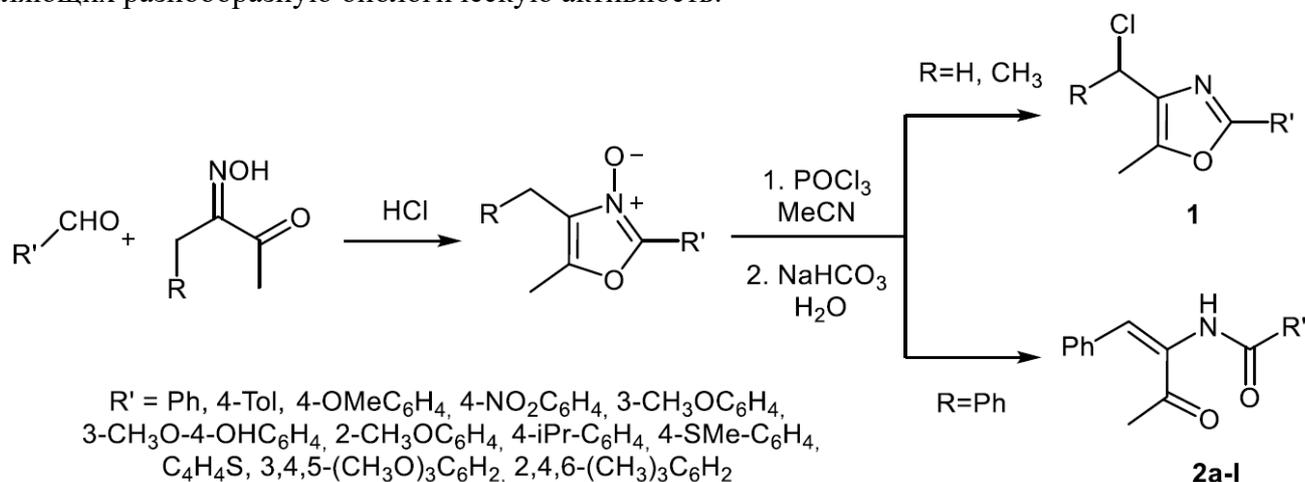


Схема 1 – Синтез *N*-оксидов 2-арилорксазолов и их перегруппировка под действием POCl<sub>3</sub>

Хотя этот процесс известен относительно давно, все описанные в литературе примеры ограничиваются *N*-оксидами оксазолов, содержащими в положениях 4 и 5 оксазольного кольца только метильные группы. Механизм данной реакции достоверно не установлен.

Для систематического исследования перегруппировки и расширения круга доступных функциональных оксазолов в данной работе нами был синтезирован ряд новых *N*-оксидов оксазолов, содержащих в 4 и 2 положениях заместители различной природы.

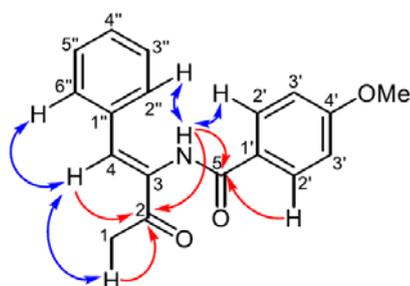


Рисунок 1 – HMBC и NOESY соединения 2e.

Проведение реакции дезоксихлорирования на полученном ряде соединений показало, что если в четвертом положении находится бензильный заместитель, то продукт реакции не является хлорпроизводным **1**, вместо этого оксазольное кольцо раскрывается с образованием бензамидов **2** (схема 1).

Первичный вывод о структуре был сделан на основании данных ЯМР <sup>1</sup>H, <sup>13</sup>C а также корреляционных спектров <sup>1</sup>H—<sup>13</sup>C HSQC, HMBC и NOESY для соединения **2e** (рис.1).

## Библиографический список

1. Y. Goto, M. Yamazaki, *Chem. Pharm. Bull. (Tokyo)*. **1970**, *18*, 756–762.
2. D. A. Brooks, G. J. Etgen, C. J. Rito, A. J. Shuker, S. J. Dominianni, et al., *J. Med. Chem.* **2001**, *44*, 2061–2064.
3. A. Bénardeau, J. Benz, A. Binggeli, D. Blum, M. Boehringer, et al., *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2009**, *19*, 2468–2473.