

8-Метил-12-циано-[5](1,8)-индолизинофан (V). Смесь 0,60 г (3,3 ммоль) соединения IV и 0,90 г (6,6 ммоль) бромацетона в минимальном объеме ацетона кипятят 6 ч. Растворитель упаривают, остаток разбавляют 5 мл этанола, добавляют Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> и кипятят 1 ч. Получают 0,48 г (65%) соединения V. T<sub>пл</sub> 134...135 °С (гексан). Спектр ПМР (CDCl<sub>3</sub>): 1,36...1,85 (8H, м, CH<sub>2</sub>); 2,20...2,21 (3H, д, J=0,6 Гц, CH<sub>3</sub>); 2,99...3,06 (4H, м, CH<sub>2</sub>); 6,26...6,27 (1H, м, 11-H); 7,12...7,13 (1H, м, 7-H); 8,06...8,07 м. д. (1H, д, J=1,4 Гц, 9-H). ИК спектр: 2230 (CN), 2850...2940 (-CH<sub>2</sub>-), 3010 см<sup>-1</sup> (CH).

Данные элементного анализа соответствуют вычисленным.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований, код 96-03-33389.

Г. П. Шкиль, Л. В. Лебединская, Р. С. Сагитуллин

Омский государственный университет,  
Омск 644077, Россия  
e-mail: shkil@univer.omsk.su

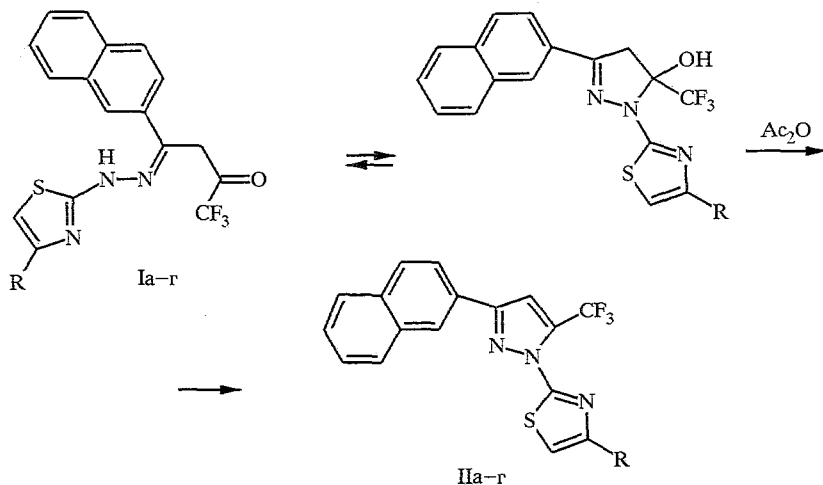
Поступило в редакцию 25.12.98

## НОВЫЙ УДОБНЫЙ МЕТОД СИНТЕЗА 2-(3-(β-НАФТИЛ)-5-ТРИФТОРМЕТИЛПИРАЗОЛ-1-ИЛ)ТИАЗОЛОВ

При взаимодействии 2-гидразоно- и 2-гидразидопроизводных тиазола с уксусным ангидридом образуются продукты ацилирования по циклическому или экзоциклическому атомам азота [1]. Мы обнаружили, что в уксусном ангидриде 2-(1-нафтил-2-трифторацетилэтилиденгидразоны) тиазола Ia—г превращаются в 2-(3-(β-нафтил)-5-трифторметилпиразол-1-ил)тиазолы IIa—г.

При взаимодействии 2-гидразино-4-R-тиазолов с 4,4,4-трифторо-1-(β-нафтил)-1,3-бутандионом и этил-4,4,4-трифторацетоацетатом в этаноле выделены лишь соединения Ia—г, а не ароматические бициклы IIa—г, что наблюдалось в аналогичных условиях в работе [2].

Строение соединений IIa—г было подтверждено методами спектроскопии ИК, ЯМР <sup>1</sup>H, <sup>19</sup>F, <sup>13</sup>C, масс-спектрометрии и элементным анализом.



I, II a R = Ph, б R = CH<sub>3</sub>, в R = *p*-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>-Cl, г R = COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

Данная реакция представляет собой препаративно удобный метод синтеза бициклов II, в ряду которых найдены вещества, обладающие противоспалительной и антигельминтной активностью.

2-(3-( $\beta$ -Нафтил)-5-трифторметилпиразол-1-ил)-4-фенилтиазол (IIa, C<sub>23</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>S). Выход 92%. T<sub>пл</sub> 163...165 °C. ИК спектр: 1530, 1290, 1225, 1165, 1130, 1050, 965 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (250 МГц, ДМСО-D<sub>6</sub>): 7,35...7,67 (5H, м, 4-,5-H<sub>5</sub>(NF) + 3-,4-,5-H<sub>5</sub>(Ph)); 7,93...8,20 (7H, м, 2-,6-H<sub>6</sub>(Ph) + 3-,6-,7-,8-H(NF) + H<sub>пир</sub>); 8,11 (1H, с, H<sub>(5)тиаз</sub>); 8,6 (1H, уш. с, 2-H(NF)). Спектр ЯМР <sup>13</sup>C (250 МГц, CDCl<sub>3</sub>, приведены химические сдвиги сигналов углеродных ядер гетероциклов пиразола и тиазола): 109,4 (C<sub>(5)пир</sub>); 110,4 (C<sub>(5)тиаз</sub>); 133,4 (C<sub>(3)пир</sub>); 152,7 (C<sub>(4)тиаз</sub>); 152,8 (C<sub>(5)пир</sub>); 158,9 (C<sub>(2)тиаз</sub>). Масс-спектр, m/z (I, %): M<sup>+</sup> 421 (100), 402 (2), 273 (3), 210 (24), 153 (5), 134 (42), 127 (14), 102 (6), 77 (6).

2-(3-( $\beta$ -Нафтил)-5-трифторметилпиразоло-1-ил)-4-метилтиазол (IIб, C<sub>18</sub>H<sub>12</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>S). Выход 85%. T<sub>пл</sub> 117...119 °C. ИК спектр: 1525, 1280, 1215, 1175, 1120, 1040, 975 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (250 МГц, ДМСО-D<sub>6</sub>): 2,39 (3H, д, J = 0,92 Гц, CH<sub>3</sub>); 7,3 (1H, к, J = 0,92 Гц, 5-H<sub>5</sub>тиаз); 7,5...7,65 (2H, м, 4-,5-H(NF)); 7,9...8,15 (5H, м, 3-,6-,7-,8-H(NF) + H<sub>пир</sub>); 8,55 м. д. (1H, м, 2-H(NF)). Масс-спектр, m/z (I, %): M<sup>+</sup> 359 (100), 340 (5), 326 (20), 287 (11), 266 (5), 197 (4), 165 (17), 153 (9), 127 (28), 101 (4), 72 (18).

2-(3-( $\beta$ -Нафтил)-5-трифторметилпиразол-1-ил)-4-(4-хлорфенил)тиазол (IIв, C<sub>23</sub>H<sub>13</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>3</sub>S). Выход 96%. T<sub>пл</sub> 172...174 °C. ИК спектр: 1530, 1430, 1380, 1280, 1220 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (250 МГц, ДМСО-D<sub>6</sub>): 7,45...7,68 (2H, м, 4-,5-H(NF)); 7,95...8,15 (5H, м, 3-,6-,7-,8-H(NF) + H<sub>пир</sub>); 7,55 (2H, д. д, J = 8,5 Гц, 2-,6-H(Ph)); 7,98 (2H, д. д, J = 8,5 Гц, 3-,5-H(Ph)); 8,16 (1H, с, 5-H<sub>5</sub>тиаз); 8,58 (1H, м, 2-H(NF)). Масс-спектр, m/z (I, %): M<sup>+</sup> 455/457 (100/40), 302 (3), 168/170 (30/3), 136/138 (5/2), 273 (3), 227 (23), 153 (6), 127 (18), 89 (6).

2-(3-( $\beta$ -Нафтил)-5-трифторметилпиразол-1-ил)-4-карбэтокситиазол (IIг, C<sub>20</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S). Выход 93%. T<sub>пл</sub> 155...157 °C. ИК спектр: 1735, 1540, 1440, 1385, 1275, 1225 см<sup>-1</sup>. Спектр ПМР (250 МГц, ДМСО-D<sub>6</sub>): 1,33 (3H, т, J = 6,9 Гц, CH<sub>3</sub>); 4,34 (2H, к, J = 6,9 Гц, CH<sub>2</sub>); 7,50...7,65 (2H, м, 4-,5-H(NF)); 7,90...8,15 (5H, м, 3-,6-,7-,8-H(NF) + H<sub>пир</sub>); 8,46 (1H, с, 5-H<sub>5</sub>тиаз); 8,75 (1H, м, 2-H(NF)). Масс-спектр, m/z (I, %): M<sup>+</sup> 417 (100), 388 (10), 372 (21), 344 (8), 305 (7), 262 (62), 233 (12), 186 (33), 153 (15), 127 (40), 101 (8), 77 (10).

*Работа проведена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (грант 98-03-33044-а).*

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Глухарева Т. В., Денисова А. Б., Мокрушин В. С. Молодежная научная школа по орг. химии. — Екатеринбург, 1998. — С. 41.
2. Singh S. P., Seligal S., Singh Tarar L., Dhawan S. N. // Indian J. Chem. — 1990. — Vol. 29B. — P. 310.

А. Б. Денисова, Т. В. Глухарева,  
В. С. Мокрушин, В. А. Бакулев

Уральский государственный технический  
университет, Екатеринбург 620002, Россия  
e-mail: morjerine@htf.ustu.ru  
ХГС. — 1999. — № 1. — С. 127

Поступило в редакцию 01.10.98