

**В. В. Захарычев, А. В. Кузенков**

**СИНТЕЗ ЗАМЕЩЕННЫХ  
2-АЗОЛИЛ-1-(2-АРИЛЭТЕНИЛ)-1-ПИРИДИНИЛЭТАНОЛОВ-1**

Получен ряд новых 2-азолил-1-(2-арилэтенил)-1-пиридинилэтанолов-1 с различным положением атома азота в пиридиновом фрагменте и заместителями в фенильном кольце по реакции (2-арилэтенилоксиран-2-ил)пиридинов с триазолом и имидазолом для агрохимического скрининга. Указанные соединения проявили высокую фунгицидную активность.

**Ключевые слова:** 2-азолилэтанола, 2-арилэтенил-1-пиридинилэтанола, реакция Кори–Чайковского.

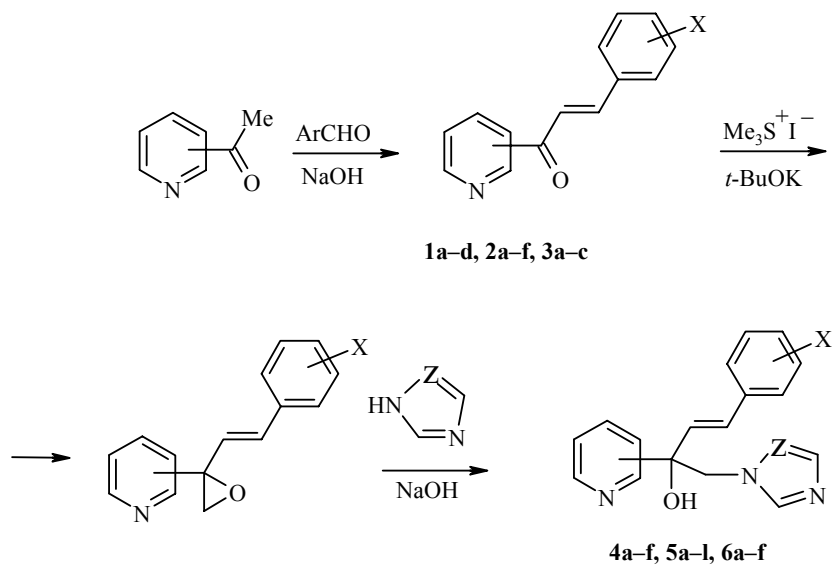
Азольные препараты составляют самый большой класс из имеющихся на сегодняшний день антимикотиков и более 20 из них хорошо известны на рынке медицинских препаратов. В сельском хозяйстве для защиты растений от патогенных грибов используется около 40 соединений этого класса [1]. Все азольные фунгициды действуют за счет ингибирования C-14-деметилазы гриба, что приводит к накоплению в клетке C-14-метилсодержащих стеролов, увеличению проницаемости мембраны и как следствие этого – нарушению работы мембранных белков. В итоге эти процессы приводят к гибели клетки гриба [2].

Введение пиридинового фрагмента повышает основность соединений и их растворимость в воде, что может привести к изменению их системных свойств и спектра фунгицидной активности.

Ранее нами были синтезированы замещенные 1-арил-2-азолил-1-пиридинилэтанола и 2-азолил-1-пиридинил-1-циклогексилэтанола [3], полученные соединения оказались биологически активными. В настоящей работе мы получили их винилога – 2-азолил-1-(2-арилэтенил)-1-пиридинилэтанола-1.

Для их синтеза 2-, 3- или 4-ацетилпириндин конденсировали с замещенными бензальдегидами в присутствии основания [4]. Полученные 3-арил-1-пиридинилпропеноны-1 вводили в реакцию с триметилсульфониййодидом по реакции Кори–Чайковского [5], образовавшиеся оксираны обрабатывали имидазолом или 1,2,4-триазолом при катализе твердым NaOH в ДМФА при нагревании [6].

Особого внимания заслуживает тот факт, что полученные оксираны оказались нестойкими соединениями и в течение нескольких часов при комнатной температуре претерпевали перегруппировку в соединения, не содержащие оксиранового цикла и олефиновой связи (данные спектроскопии ЯМР  $^1\text{H}$ ). Предположительно, здесь происходило образование 2-арил-4-пиридинил-2,5-дигидрофуранов. Аналогичная перегруппировка



1, 4 2-Py, 2, 5 3-Py, 4, 6 4-Py; X = F, Cl, Br

Т а б л и ц а 1

**Выходы и температуры плавления 1-пиридинил-3-арилпропен-2-онов-1 1-3**

Соединение	X	$R_f^*$	Т. пл., °С	Выход, %
<b>1a</b>	H	0.78	70–72 (71 [4])	52
<b>1b</b>	4-Cl	0.83	90–92 (91–92 [4])	30
<b>1c</b>	4-Br	0.83	97–99 (97–100 [4])	52
<b>1d</b>	3-CF <sub>3</sub>	0.88	Масло	13
<b>2a</b>	H	0.62	83–85 (84–85 [4])	60
<b>2b</b>	4-Cl	0.84	132–134 (134–135 [4])	63
<b>2c</b>	4-Br	0.66	142–144 (144–145 [4])	67
<b>2d</b>	4-F	0.2	120–122 (122 [4])	74
<b>2e</b>	2,4-Cl <sub>2</sub>	0.6	118–120	26
<b>2f</b>	3-CF <sub>3</sub>	0.51	Масло	48
<b>3a</b>	H	0.64	85–87 (87–88 [4])	58
<b>3b</b>	4-Cl	0.82	138–140 (139–141 [4])	46
<b>3c</b>	4-Br	0.65	148–150 (147–148 [4])	30

\* Хлороформ–этанол, 10:1.

Подавление радиального роста мицелия грибов *in vitro* соединениями 4–6  
в  $c = 30$  мг/л в сравнении с необработанным контролем

Соединение	Подавление роста патогена, %				
	<i>Venturia inaequalis</i>	<i>Fusarium moniliforme</i>	<i>Fusarium oxysporum</i>	<i>Helminthosporium sativum</i>	<i>Sclerotinia sclerotiorum</i>
4a	70–89	70–89	50–69	99–100	0–49
4b	99–100	90–98	90–98	99–100	99–100
4c	99–100	99–100	99–100	99–100	99–100
4e	50–69	70–89	0–49	99–100	0–49
5b	50–69	0–49	0–49	0–49	0–49
5c	70–89	50–69	0–49	90–98	0–49
5d	0–49	0–49	0–49	0–49	0–49
5e	50–69	0–49	0–49	0–49	0–49
5g	0–49	0–49	0–49	0–49	0–49
6c	0–49	50–69	0–49	70–89	0–49
6f	0–49	50–69	0–49	50–69	0–49
Эталон*	50–69	90–98	70–89	50–69	50–69

\* Эталон – коммерческий фунгицид триадимефон (1-(4-хлорфенокси)-3,3-диметил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)бутан-2-он).

наблюдалась при эпоксидировании 2,2-диметил-6-фурфурилиденциклогексанолов [7]. По этой причине оксираны не очищали, а использовали в реакции с триазолом или имидазолом в эфирном растворе.

Полученные соединения были испытаны *in vitro* на фунгицидную активность против пяти фитопатогенных грибов: *Venturia inaequalis* Wint, *Fusarium moniliforme* Sheldon, *Fusarium oxysporum* Schlecht, *Helminthosporium sativum* Pammel, King et Bakke и *Sclerotinia sclerotiorum* (Lib.) de Bary [8]. Наивысшая активность обнаружена у производных 2-замещенного пиридина, у некоторых из них (например 4c и 4b) превосходила активность эталона – коммерческого азольного фунгицида триадимефона (табл. 4).

### ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  получены на приборе Bruker AC-400 (400 МГц) в  $\text{DMSO-d}_6$ , внутренний стандарт ТМС.

**1-(Пиридин-2-ил)-3-фенилпропен-2-он-1 (1a).** К смеси 3 г (25 ммоль) 2-ацетилпиридина и 2.85 г (27 ммоль) бензальдегида в 150 мл воды при перемешивании прибавляют по каплям 7.5 мл 10 % раствора NaOH, перемешивают при комнатной температуре 8 ч. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают несколько раз водой, сушат и перекристаллизовывают из этанола. Получают 3.17 г (60%) соединения 1a.  $R_f$  0.78 ( $\text{CHCl}_3$ -EtOH, 10:1), т. пл. 70–72 °C (т. пл. 71 °C [4]).

**Другие азакалконы** получают аналогично (табл. 1). В случае использования твердого бензальдегида перед прибавлением катализатора добавляют 10–15 мл бензола и перемешивают реакционную смесь до полного растворения твердого вещества.

Т а б л и ц а 2

## Характеристики 2-азолил-1-(2-арилэтенил)-1-пиридинилэтанолов-1 4–6

Соединение*	Этанол	X	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	Выход, %
				С	Н	N		
<b>4a</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-2-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>18</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O	<u>74.19</u> 74.20	<u>5.62</u> 5.88	<u>14.32</u> 14.42	145–147	16
<b>4b</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-2-ил)-1-[2-(4-хлорфенил)этенил]-	4-Cl	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> ClN <sub>3</sub> O	–	–	–	178–180	14
<b>4c</b>	1-(Пиридин-2-ил)-2-(имидазол-1-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> BrN <sub>3</sub> O	<u>58.31</u> 58.39	<u>4.40</u> 4.36	<u>11.23</u> 11.35	180–182	37
<b>4d</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-2-ил)-1-[2-(3-трифторметилфенил)этенил]-	3-CF <sub>3</sub>	C <sub>19</sub> H <sub>16</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O	<u>63.50</u> 63.51	<u>4.53</u> 4.49	<u>11.61</u> 11.69	Масло	3
<b>4e</b>	1-(Пиридин-2-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>17</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O	<u>69.67</u> 69.85	<u>5.57</u> 5.52	<u>19.72</u> 19.70	128–130	16
<b>4f</b>	1-(Пиридин-2-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> BrN <sub>4</sub> O	<u>54.93</u> 55.00	<u>4.10</u> 4.07	<u>15.01</u> 15.09	Масло	1
<b>5a</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>18</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O	<u>74.23</u> 74.20	<u>5.78</u> 5.88	<u>14.36</u> 14.42	115–117	57
<b>5b</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-[2-(4-хлорфенил)этенил]-	4-Cl	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> ClN <sub>3</sub> O	<u>66.31</u> 66.36	<u>5.01</u> 4.95	<u>12.86</u> 12.90	118–120	41
<b>5c</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> BrN <sub>3</sub> O	<u>58.38</u> 58.39	<u>4.41</u> 4.36	<u>11.30</u> 11.35	120–122	49
<b>5d</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-[2-(4-фторфенил)этенил]-	4-F	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O	–	–	–	110–112	47
<b>5e</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-[2-(2,4-дихлорфенил)этенил]-	2,4-Cl <sub>2</sub>	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O	<u>59.94</u> 60.01	<u>4.25</u> 4.20	<u>11.60</u> 11.66	105–107	27

<b>5f</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-3-ил)-1-[2-(3-трифторметилфенил)этенил]-	3-CF <sub>3</sub>	C <sub>19</sub> H <sub>16</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O	<u>63.54</u> 63.51	–	–	108–110	37
<b>5g</b>	1-(Пиридин-3-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>17</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O	<u>69.84</u> 69.85	<u>5.54</u> 5.52	<u>19.11</u> 19.17	88–90	19
<b>5h</b>	1-(Пиридин-3-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-хлорфенил)этенил]-	4-Cl	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> ClN <sub>4</sub> O	<u>62.45</u> 62.48	<u>4.68</u> 4.63	<u>17.08</u> 17.15	98–100	38
<b>5i</b>	1-(Пиридин-3-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> BrN <sub>4</sub> O	<u>54.91</u> 55.00	<u>4.10</u> 4.07	<u>15.00</u> 15.09	95–97	43
<b>5k</b>	1-(Пиридин-3-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-фторфенил)этенил]-	4-F	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>4</sub> O	–	–	–	24	89–91
<b>5l</b>	1-(Пиридин-3-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(3-трифторметилфенил)этенил]-	3-CF <sub>3</sub>	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O	–	–	–	Масло	4
<b>6a</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-4-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>18</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O	–	<u>5.86</u> 5.88	<u>14.43</u> 14.42	100–102	26
<b>6b</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-4-ил)-1-[2-(4-хлорфенил)этенил]-	4-Cl	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> ClN <sub>3</sub> O	<u>66.34</u> 66.36	<u>5.01</u> 4.95	<u>12.82</u> 12.90	Масло	3
<b>6c</b>	2-(Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-4-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> BrN <sub>3</sub> O	<u>58.37</u> 58.39	<u>4.39</u> 4.36	<u>11.30</u> 11.35	133–135	12
<b>6d</b>	1-(Пиридин-4-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-(2-фенилэтенил)-	H	C <sub>17</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O	<u>69.85</u> 69.85	<u>5.55</u> 5.52	<u>19.72</u> 19.70	191–193	5
<b>6e</b>	1-(Пиридин-4-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-хлорфенил)этенил]-	4-Cl	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> ClN <sub>4</sub> O	<u>62.45</u> 62.48	<u>4.66</u> 4.63	<u>17.09</u> 17.15	215–217	42
<b>6f</b>	1-(Пиридин-4-ил)-2-(1,2,4-триазол-1-ил)-1-[2-(4-бромфенил)этенил]-	4-Br	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> BrN <sub>4</sub> O	<u>54.98</u> 55.00	<u>4.12</u> 4.07	<u>15.00</u> 15.09	216–218	22

\* **4a–d**, **5a–f**, **6a–c** Z = CH, **4e,f**, **5g–l**, **6d–f** Z = N.

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  2-азолил-1-(2-арилэтенил)-1-пиридинилэтанолов-1 4-6

Соединение	Химические сдвиги, $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц)
1	2
<b>4a</b>	4.50 (2H, АВ-система, $J = 15.4$ , $\text{CH}_2$ ); 6.38 (1H, с, ОН); 6.62, 6.75 (2H, АВ-система, $J = 16.4$ , СН метин.); 6.69, 6.88 (2H, 2с, Н имидазола); 7.22 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.30–7.38 (6H, м, $\text{C}_6\text{H}_5$ , 1H имидазола); 7.57 (1H, д, $J = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.78 (1H, т, $J_1 = 8.6$ , $J_2 = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.60 (1H, с, $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>4b</b>	4.50 (2H, АВ-система, $J = 14$ , $\text{CH}_2$ ); 6.20 (1H, с, ОН); 6.60, 6.79 (2H, АВ-система, $J = 15.6$ , СН метин.); 6.67, 6.87 (2H, 2с, Н-2 имидазола); 7.29 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.35 (1H, с, Н имидазола); 7.38, 7.43 (4H, $\text{A}_2\text{B}_2$ -система, $J = 8$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.56 (1H, д, $J = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.78 (1H, т, $J_1 = 8.6$ , $J_2 = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.60 (1H, д, $J = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>4c</b>	4.50 (2H, АВ-система, $J = 1.2$ , $\text{CH}_2$ ); 6.21 (1H, с, ОН); 6.58, 6.80 (2H, АВ-система, $J = 17.3$ , СН метин.); 6.70, 6.87 (2H, 2с, Н имидазола); 7.29 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.40 (1H, с, Н имидазола); 7.35, 7.49 (4H, $\text{A}_2\text{B}_2$ -система, $J = 8.6$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.56 (1H, д, $J = 8.4$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.77 (1H, т, $J_1 = 8.4$ , $J_2 = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.60 (1H, д, $J = 6.3$ , $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>4d</b>	4.75 (2H, АВ-система, $J = 16$ , $\text{CH}_2$ ); 6.20 (1H, с, ОН); 6.60 (1H, с, Н имидазола); 6.67, 6.88 (2H, АВ-система, $J = 15.3$ , СН метин.); 6.82 (1H, с, Н имидазола); 7.30 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.38 (1H, с, Н имидазола); 7.55–7.74 (5H, м, $4\text{H}_{\text{ph}}$ , $1\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.82 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.56 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>4e</b>	4.55, 4.80 (2H, АВ-система, $J = 14.4$ , $\text{CH}_2$ ); 6.22 (1H, с, ОН); 6.58, 6.74 (2H, АВ-система, $J = 16.0$ , СН метин.); 7.22 (1H, т, $J_1 = 8.5$ , $J_2 = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.30–7.36 (5H, м, $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.60 (1H, д, $J = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.77 (1H, с, СН триазола); 7.80 (1H, д, $J = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.32 (1H, с, Н триазола); 8.58 (1H, д, $J = 2.6$ , $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>4f</b>	4.60 (2H, АВ-система, $J = 12.3$ , $\text{CH}_2$ ); 6.35 (1H, с, ОН); 6.45, 6.82 (2H, АВ-система, $J = 15.4$ , СН метин.); 7.32 (1H, м, $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.36, 7.50 (4H, $\text{A}_2\text{B}_2$ -система, $J = 8.7$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.58 (1H, д, $J = 7.6$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.81 (1H, т, $J_1 = 7.6$ , $J_2 = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.21 (2H, с, Н триазола); 8.61 (1H, д, $J = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>5a</b>	4.40, 4.46 (2H, АВ-система, $J = 12.5$ , $\text{CH}_2$ ); 6.16 (1H, с, ОН); 6.60, 6.79 (2H, АВ-система, $J = 16.3$ , СН метин.); 6.70, 6.92 (2H, 2с, Н имидазола); 7.24 (1H, т, $J_1 = 6.3$ , $J_2 = 4.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.31–7.43 (5H, м, $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.38 (1H, с, Н имидазола); 7.98, 8.42 (2H, 2д, $J = 6.3$ , $J = 4.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.72 (1H, с, $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>5b</b>	4.37, 4.48 (2H, АВ-система, $J = 4.0$ , $\text{CH}_2$ ); 6.18 (1H, с, ОН); 6.58, 6.84 (2H, АВ-система, $J = 16.0$ , СН метин.); 6.70, 6.92 (2H, 2с, Н имидазола); 7.35 (1H, м, $\text{CH}_{\text{py}}$ ); 7.35, 7.47 (1H, с, Н имидазола); 7.45 (4H, $\text{A}_2\text{B}_2$ -система, $J = 8.6$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.87, 8.45 (2H, 2д, $J_1 = 6.3$ , $J_2 = 4.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.72 (1H, с, $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>5c</b>	4.43 (2H, АВ-система, $J = 6.0$ , $\text{CH}_2$ ); 6.18 (1H, с, ОН); 6.57, 6.85 (2H, АВ-система, $J = 14.6$ , СН метин.); 6.70, 6.92 (2H, 2с, Н имидазола); 7.35 (1H, д, д, $J_1 = 7.3$ , $J_2 = 4.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.38 (1H, с, Н имидазола); 7.40, 7.52 (4H, $\text{A}_2\text{B}_2$ -система, $J = 7.4$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.87, 8.45 (2H, 2д, $J_1 = 6.3$ , $J_2 = 4.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.72 (1H, с, $\text{H}_{\text{py}}$ )
<b>5d</b>	4.45 (2H, АВ-система, $J = 14.2$ , $\text{CH}_2$ ); 6.16 (1H, с, ОН); 6.59, 6.76 (2H, АВ-система, $J = 16.7$ , СН метин.); 6.71, 6.92 (2H, 2с, Н имидазола); 7.16, 7.48 (4H, $\text{AA}'\text{BB}'\text{X}$ -система, $J_1 = 10.6$ , $J_2 = 7.1$ , $\text{H}_{\text{ph}}$ ); 7.34 (1H, т, $J = 8.4$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 7.38 (1H, с, Н имидазола); 7.87, 8.43 (2H, 2д, $J = 8.4$ , $J = 5.2$ , $\text{H}_{\text{py}}$ ); 8.71 (1H, с, $\text{H}_{\text{py}}$ )

1	2
5e	4.45 (2H, АВ-система, $J = 6.0$ , CH <sub>2</sub> ); 6.31 (1H, с, OH); 6.72 (1H, с, H имидазола); 6.86, 6.94 (2H, АВ-система, $J = 16.3$ , СН метин.); 6.95 (1H, с, H имидазола); 7.36 (1H, д. д, $J_1 = 8.4$ , $J_2 = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 7.42 (2H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.59 (1H, м, H имидазола); 7.76 (1H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.90, 8.46 (2H, 2д, $J = 8.4$ , $J = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.74 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5f	4.45 (2H, АВ-система, $J = 5.0$ , CH <sub>2</sub> ); 6.23 (1H, с, OH); 6.70, 7.02 (2H, АВ-система, $J = 16.5$ , СН метин.); 6.73, 6.95 (2H, 2с, H имидазола); 7.36 (1H, м, H <sub>py</sub> ); 7.44 (1H, с, H имидазола); 7.59–7.82 (4H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.90, 8.46 (2H, 2д, $J_1 = 8.4$ , $J_2 = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.75 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5g	4.66, 4.73 (2H, АВ-система, $J = 16$ , CH <sub>2</sub> ); 6.24 (1H, с, OH); 6.62, 6.83 (2H, АВ-система, $J = 15.4$ , СН метин.); 7.25 (1H, т, $J = 7.6$ , H <sub>py</sub> ); 7.30–7.46 (5H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.78 (1H, с, H триазола); 7.88 (1H, д, $J = 7.6$ , H <sub>py</sub> ); 8.34 (1H, с, H триазола); 8.45 (1H, д, $J = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.71 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5h	4.68 (2H, АВ-система, $J = 15.0$ , CH <sub>2</sub> ); 6.27 (1H, с, OH); 6.50, 6.84 (2H, АВ-система, $J = 15.7$ , СН метин.); 7.34 (1H, д. д, $J_1 = 7.6$ , $J_2 = 4.25$ , H <sub>py</sub> ); 7.38, 7.47 (4H, А <sub>2</sub> В <sub>2</sub> -система, $J = 8.7$ , H <sub>ph</sub> ); 7.77 (1H, с, H триазола); 7.87 (1H, д, $J = 7.6$ , H <sub>py</sub> ); 8.33 (1H, с, H триазола); 8.45 (1H, д, $J = 4.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.70 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5i	4.65 (2H, АВ-система, $J = 15.3$ , CH <sub>2</sub> ); 6.27 (1H, с, OH); 6.59, 6.88 (2H, АВ-система, $J = 15.2$ , СН метин.); 7.38 (1H, д. д, $J_1 = 8.4$ , $J_2 = 4.2$ , H <sub>py</sub> ); 7.40, 7.52 (4H, А <sub>2</sub> В <sub>2</sub> -система, $J = 6.9$ , H <sub>ph</sub> ); 7.77 (1H, с, H триазола); 7.86 (1H, д, $J = 8.4$ , H <sub>py</sub> ); 8.33 (1H, с, H триазола); 8.44 (1H, д, $J = 4.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.70 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5k	4.65 (2H, АВ-система, $J = 11.8$ , CH <sub>2</sub> ); 6.24 (1H, с, OH); 6.61, 6.78 (2H, АВ-система, $J = 15.5$ , СН метин.); 7.16, 7.48 (4H, АА'ВВ'Х-система, $J_1 = 8.8$ , $J_2 = 5.9$ , H <sub>ph</sub> ); 7.33 (1H, т, $J_1 = 6.3$ , $J_2 = 4.2$ , H <sub>py</sub> ); 7.78 (1H, с, H триазола); 7.86 (1H, д, $J = 6.3$ , H <sub>py</sub> ); 8.32 (1H, с, H триазола); 8.44 (1H, д, $J = 4.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.71 (1H, с, H <sub>py</sub> )
5l	4.70 (2H, АВ-система, $J = 12.3$ , CH <sub>2</sub> ); 6.44 (1H, с, OH); 6.52, 7.04 (2H, АВ-система, $J = 15.4$ , СН метин.); 7.34 (1H, д. д, $J_1 = 7.6$ , $J_2 = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 7.58 (2H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.73 (1H, м, H <sub>ph</sub> ); 7.78 (1H, с, H триазола); 7.82 (1H, с, H <sub>ph</sub> ); 7.90 (1H, д, $J = 7.6$ , H <sub>py</sub> ); 8.35 (1H, с, H триазола); 8.45 (1H, д, $J = 5.2$ , H <sub>py</sub> ); 8.73 (1H, с, H <sub>py</sub> )
6a	4.40 (2H, АВ-система, $J = 12$ , CH <sub>2</sub> ); 6.22 (1H, с, OH); 6.60, 6.75 (2H, АВ-система, $J = 16.9$ , СН метин.); 6.70, 6.93 (2H, 2с, H имидазола); 7.20–7.47 (6H, м, 5H <sub>ph</sub> , 1H имидазола); 7.52, 8.51 (4H, 2д, $J = 3.4$ , H <sub>py</sub> )
6b	4.40 (2H, с, CH <sub>2</sub> ); 6.26 (1H, с, OH); 6.58, 6.79 (2H, АВ-система, $J = 15.3$ , СН метин.); 6.69, 6.92 (по 1H, оба с, H имидазола); 7.37–7.45 (5H, м, 1H имидазола, 4H <sub>ph</sub> ); 7.52, 8.50 (по 2H, оба д, $J = 3.4$ , H <sub>py</sub> )
6c	4.40 (2H, с, CH <sub>2</sub> ); 6.26 (1H, с, OH); 6.57, 6.82 (2H, АВ-система, $J = 16.6$ , СН метин.); 6.70 (1H, с, H имидазола); 6.94 (1H, с, H имидазола); 7.38–7.52 (7H, м, 4H <sub>ph</sub> , H <sub>py</sub> -2, 1H имидазола); 8.52 (2H, д, $J = 3.4$ , H <sub>py</sub> )
6d	4.70 (2H, уш. с, CH <sub>2</sub> ); 6.36 (1H, с, OH); 6.62, 6.78 (2H, АВ-система, $J = 13.5$ , СН метин.); 7.20–7.60 (5H, м, H <sub>ph</sub> -5); 7.77 (1H, с, H триазола); 8.23 (2H, м, H <sub>py</sub> ); 8.33 (1H, с, H триазола); 8.47 (2H, с, H <sub>py</sub> )
6e	4.70 (2H, АВ-система, $J = 12.8$ , CH <sub>2</sub> ); 6.35 (1H, с, OH); 6.60, 6.82 (2H, АВ-система, $J = 15.4$ , СН метин.); 7.38, 7.45 (4H, А <sub>2</sub> В <sub>2</sub> -система, $J = 9.1$ , H <sub>ph</sub> ); 7.50 (2H, д, $J = 3.1$ , H <sub>py</sub> ); 7.78 (1H, с, H триазола); 8.32 (1H, с, H триазола) 8.50 (1H, д, $J = 3.1$ , H <sub>py</sub> )
6f	4.65 (2H, АВ-система, $J = 12.8$ , CH <sub>2</sub> ); 6.33 (1H, с, OH); 6.58, 6.84 (2H, АВ-система, $J = 14.5$ , СН метин.); 7.38, 7.55 (4H, А <sub>2</sub> В <sub>2</sub> -система, $J = 8.1$ , H <sub>ph</sub> ); 7.53 (2H, д, $J = 3.1$ , H <sub>py</sub> ); 7.78 (1H, с, H триазола); 8.32 (1H, с, H триазола); 8.50 (2H, д, $J = 3.1$ , H <sub>py</sub> )

**2-(Пиридин-3-ил)-2-(2-фенилэтенил)оксиран.** К раствору 1.045 г (5 ммоль) соединения **2a** и 1.43 г (7 ммоль) иодида триметилсульфония в 3.5 мл ДМСО прибавляют по каплям в течение 30 мин раствор 0.7 г (6.27 ммоль) *трет*-бутилата калия в 3 мл ДМСО в инертной атмосфере при охлаждении смесью льда и соли. Затем реакционную массу перемешивают 15 мин и прибавляют по каплям 30 мл воды, экстрагируют эфиром (4 × 50 мл), экстракт промывают охлажденным насыщенным раствором хлорида натрия и сушат сульфатом магния. Растворитель отгоняют в вакууме при охлаждении ледяной водой и получают 0.95 г (85%) 2-(пиридин-3-ил)-2-(2-фенилэтенил)оксирана. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (J, Гц): 3.23 (2H, АВ-система, J = 5.9, CH<sub>2</sub>); 6.50, 6.69 (2H, АВ-система, J = 15.2, CH<sub>2</sub>), 7.25–7.52 (6H, м, 5H<sub>Ph</sub>, 1H<sub>Py</sub>), 7.86, 8.58, 8.68 (по 1H, м, 3H<sub>Py</sub>).

Полученное соединение неустойчиво и при комнатной температуре перегруппировывается в **4-(пиридин-3-ил)-2-фенил-2,5-дигидрофуран**. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (J, Гц): 2.65 (2H, АВ-система, J = 1.7, CH<sub>2</sub>); 3.35 (1H, д, J = 4.7, H-бензильн.); 7.22 (1H, д, д, J<sub>1</sub> = 4.7, J<sub>2</sub> = 1.7, CH-метин.); 7.30 (5H, м, H<sub>Ph</sub>); 7.58 (1H, д, д, J<sub>1</sub> = 8.4; J<sub>2</sub> = 4.7, H<sub>Py</sub>-5); 8.38 (1H, д, J = 8.4, H<sub>Py</sub>-4); 8.82 (1H, д, J = 4.1, H<sub>Py</sub>-6); 9.20 (1H, с, H<sub>Py</sub>-2). Найдено, %: С 80.63; Н 5.91; N 6.24. C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>NO. Вычислено, %: С 80.69; Н 5.87; N 6.27.

**2-(1-Имидазол-1-ил)-1-(пиридин-2-ил)-1-(2-фенилэтенил)этанол-1 (4a).** К раствору 1.045 г (5 ммоль) 1-(2-пиридинил)-3-фенилпропен-2-ола-1 и 1.43 г (7 ммоль) иодида триметилсульфония в 3.5 мл ДМСО прибавляют по каплям в течение 30 мин раствор 0.7 г (6.27 ммоль) *трет*-бутилата калия в 3 мл ДМСО в инертной атмосфере при охлаждении смесью льда и соли, перемешивают 15 мин и прибавляют по каплям 30 мл воды, экстрагируют эфиром (4 × 50 мл), экстракт промывают насыщенным раствором хлорида натрия и сушат сульфатом магния. К эфирному раствору оксирана добавляют 0.245 г (3.5 ммоль) имидазола, 0.04 г (1 ммоль) гидроксида натрия и упаривают эфир в вакууме без нагревания, остаток растворяют в 2 мл ДМФА, добавляют 1 каплю воды, нагревают 2 ч при 100 °С, охлаждают, выливают в 25 мл воды и оставляют на несколько часов. Выпавшие кристаллы отфильтровывают и перекристаллизовывают из этанола. Получают 0.205 г (16%) соединения **4a**.

Аналогично получают другие 2-азолил-1-(2-арилэтенил)-1-пиридинилэтанола-1 **4-6** (табл. 2, 3).

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. R. Griffin, T. Tracy, *Antifungal Drugs*, in D. A. Williams, Th. L. Lemke, *Foye's Principles of Medicinal Chemistry*, Lippincott Williams & Wilkins, Philadelphia etc., 2002, p. 891.
2. Б. А. Хаскин, *ЖВХО*, **33**, 699 (1988).
3. А. В. Кузенков, *ХТС*, 1693 (2003). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **39**, 1492 (2003)].
4. J. Durinda, L. Szucs, L. Krasnec, J. Heder, V. Springer, J. Kolena, J. Keleti, *Acta Fac. Pharm. Bohemosl.*, **12**, 89 (1966).
5. E. J. Corey, M. Chaykovsky, *J. Am. Chem. Soc.*, **87**, 1364 (1965).
6. J. W. Bentley, R. V. Jones, P. J. Wareham, *Tetrahedron Lett.*, **30**, 4016 (1989).
7. С. В. Попков, Л. В. Коваленко, В. П. Тащи, Л. Я. Богельфер, *Изв. АН, Сер. хим.*, 1439 (1994).
8. В. В. Захарычев, А. В. Кузенков, Пат. РФ 2247724; *Б. И.*, № 7 (2005).

Российский химико-технологический университет  
им. Д. И. Менделеева, 125047 Москва  
e-mail: lexsender1@rambler.ru  
e-mail: sensei@hotmail.ru

Поступило 22.03.2006