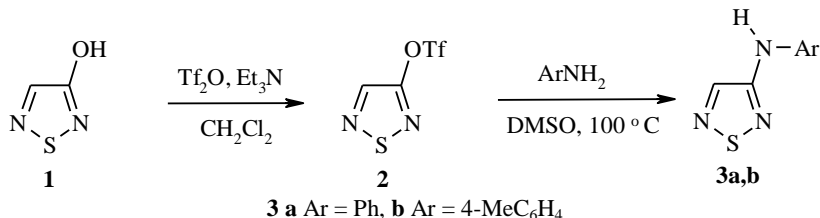


## АРИЛАМИНИРОВАНИЕ 1,2,5-ТИАДИАЗОЛ-3-ИЛТРИФТОРМЕТАНСУЛЬФОНАТА

**Ключевые слова:** N-арил-1,2,5-тиадиазол-3-амин, 1,2,5-тиадиазол-3-илтрифторметан-сульфонат, аминирование.

В настоящее время отсутствует удобный метод синтеза 3-ариламино-производных 1,2,5-тиадиазола.

Нами найдено, что полученный из 3-гидрокси-1,2,5-тиадиазола **1** три-флат **2** гладко реагирует с ароматическими аминами с образованием труднодоступных ранее [1] 3-ариламинопроизводных 1,2,5-тиадиазола **3**.



Единственный пример подобной реакции гетарилтрифлатов с ароматическими аминами без использования катализаторов известен [2] для хино-лин-2-ил трифторметансульфоната и анилина.

Спектры ЯМР <sup>1</sup>H и <sup>19</sup>F снимали на приборе Varian VXR-300, внутренний стандарт ТМС (<sup>1</sup>H) и FCCL<sub>3</sub> (<sup>19</sup>F).

**1,2,5-Тиадиазол-3-ил трифторметансульфонат (2).** Выход 85%, т. кип. 50–52 °С (15 мм рт. ст.), *n*<sub>D</sub><sup>15</sup> 1.4368, *d*<sub>4</sub><sup>15</sup> 1.6. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (299 МГц, CDCl<sub>3</sub>), δ, м. д.: 8.45 (1H, с, Н-4). Спектр ЯМР <sup>19</sup>F (282 МГц, CDCl<sub>3</sub>), δ, м. д.: –72.0 (3F, с, CF<sub>3</sub>). Найдено, %: С 15.28; Н 0.39; F 24.11; N 11.85; S 27.1. C<sub>3</sub>HF<sub>3</sub>N<sub>2</sub>O<sub>3</sub>S<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 15.39; Н 0.43; F 24.34; N 11.96; S 27.38.

**N-Фенил-1,2,5-тиадиазол-3-амин (3a).** Выход 64%, т. пл. 80–82 °С; по данным [1] т. пл. 80 °С. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (299 МГц, CDCl<sub>3</sub>), δ, м. д. (*J*, Гц): 6.99 (1H, уш. с, NH); 7.07 (1H, т, *J* = 7.2, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>); 7.36 (2H, д, д, *J* = 7.2, *J* = 8.1, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>); 7.5 (2H, т, *J* = 8.1, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>); 8.08 (1H, с, Н-4).

**N-(4-Метилфенил)-1,2,5-тиадиазол-3-амин (3b).** Выход 52%, т. пл. 96–98 °С. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H (299 МГц, CDCl<sub>3</sub>), δ, м. д. (*J*, Гц): 2.33 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.9 (1H, уш. с, NH); 7.17 (2H, д, *J* = 8.2, Ar); 7.37 (2H, д, *J* = 8.2, Ar); 8.05 (1H, с, Н-4). Найдено, %: С 56.52; Н 4.74; N 21.97; S 16.76. C<sub>9</sub>H<sub>9</sub>N<sub>3</sub>S. Вычислено, %: С 56.38; Н 4.78; N 21.71; S 16.89.

### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. J. Rokach, P. Hamel, Y. Girard, G. Reader, *J. Org. Chem.*, **44**, 1118 (1979).
2. S. Sacchi, A. Carangio, G. Fabrizi, L. Moro, P. Pace, *Synlett*, **12**, 1400 (1997).

**Ю. М. Пустовит, А. Н. Алексеенко**

*Институт органической химии  
НАН Украины, Киев 02660  
e-mail: [yprus@email.com](mailto:yprus@email.com)*

*Поступило в редакцию 29.12.2004*

ХГС. – 2005. – № 6. – С. 924.