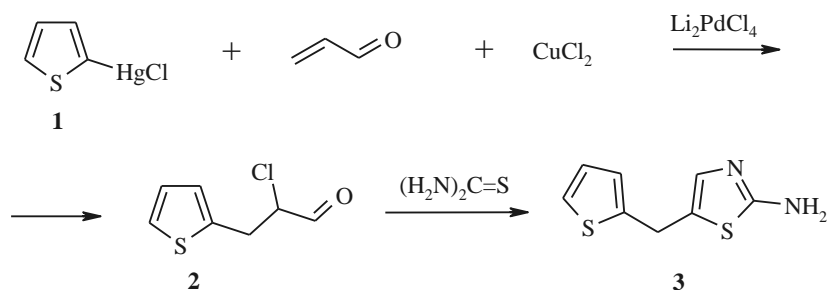


## МЕТОД СИНТЕЗА 2-АМИНО-5-(2-ТИЕНИЛМЕТИЛ)ТИАЗОЛА

**Ключевые слова:** производные тиазола, 2-хлор-3-(2-тиенил)пропаналь, гетероциклизация, Pd-катализ, реакция с тиомочевинной.

$\alpha$ -Галогензамещенные альдегиды являются удобными реагентами в синтезе производных тиазола. Однако круг таких альдегидов ограничен, поэтому 5-замещенные тиазолы менее доступны, чем производные тиазола, содержащие заместители в положении 4, которые получают из  $\alpha$ -галогенкетонатов [1, 2]. Ранее нами разработан метод синтеза 2-амино-5-(R-бензил)тиазолов из 3-арил-2-хлорпропионовых альдегидов, полученных взаимодействием хлоридов арендиазония с акролеином [3]. В настоящем сообщении предложен метод синтеза тиазолов, содержащих 2-тиенилметильную группу в положении 5.

Взаимодействием хлорида 2-тиенилртути **1** с акролеином в присутствии  $\text{Li}_2\text{PdCl}_4$  и избытка хлорида меди(II) (вариант реакции Хека [4, 5]) получен 3-(2-тиенил)-2-хлорпропаналь (**2**). Альдегид **2** при взаимодействии с тиомочевинной циклизуется с образованием соединения **3**.



Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  сняты на приборе Mercury 400 (400 МГц) в  $\text{DMSO-d}_6$ .

**3-(2-Тиенил)-2-хлорпропаналь (2).** Перемешивают 4 сут смесь 16 г (50 ммоль) хлорида 2-тиенилртути **1**, 5 мл (70 ммоль) акролеина, 38.5 г (226 ммоль)  $\text{CuCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ , 2 г  $\text{LiCl}$  и 80 мг  $\text{PdCl}_2$  в 30 мл уксусной кислоты. Реакционную смесь разбавляют 350 мл воды, фильтруют. Фильтрат экстрагируют хлороформом, сушат  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ , растворитель упаривают, остаток перегоняют в вакууме. Выход 3.6 г (41%). Т. кип. 93 °С (5 мм рт. ст.),  $n_D^{20}$  1.5513. Найдено, %: С 47.82; Н 3.96; Cl 20.13.  $\text{C}_7\text{H}_7\text{ClOS}$ . Вычислено, %: С 48.14; Н 4.04; Cl 20.30.

**2-Амино-5-(2-тиенилметил)тиазол (3).** Раствор 1.5 г (20 ммоль) тиомочевинной и 3.3 г (19 ммоль) альдегида **2** в 10 мл этанола кипятят 30 мин. Смешивают с 40 мл воды, подкисляют  $\text{HCl}$  и нагревают. Прозрачный раствор отделяют от остатка и подщелачивают аммиачной водой. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают водой, высушивают и перекристаллизовывают из этанола. Выход 1.9 г (51%). Т. пл. 113 °С. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 4.12 (2H, с,  $\text{CH}_2$ ); 6.74 (1H, с, Н-4 тиазол); 6.78 (2H, с,  $\text{NH}_2$ ); 6.89 (1H, ш. с, Н-3 тиазола); 6.94 (1H, м, Н-4 тиазола); 7.35 (1H, д,  $J = 4.0$ , Н-5 тиазола). Найдено, %: С 48.75; Н 4.03; S 32.52.  $\text{C}_8\text{H}_8\text{N}_2\text{S}_2$ . Вычислено, %: С 48.95; Н 4.11; S 32.67.

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Дж. Спрейг, А. Ленд, в кн. *Гетероциклические соединения*, под ред. Р. Эльдерфилда, Изд-во иностр. лит., Москва, 1961, **5**, с. 395.
2. И. К. Моисеев, М. Н. Земцова, Н. В. Макарова, *ХГС*, 867 (1994).
3. Н. Д. Обушак, В. С. Матийчук, Н. И. Ганушак, *ЖОрХ*, **33**, 1081 (1997).
4. R. F. Heck, *J. Am. Chem. Soc.*, **90**, 5538 (1968).
5. R. F. Heck, *J. Am. Chem. Soc.*, **90**, 5518 (1968).

В. С. Матийчук, Ю. О. Тесленко, Н. Д. Обушак

*Львовский национальный университет  
им. Ивана Франко, Львов 79005, Украина  
e-mail: obushak@in.lviv.ua*

*Поступило в редакцию 02.06.2004*

ХГС. – 2004. – № 11. – С. 1733

---