

## Синтез флуоровмісних похідних анельованих піридинів

Світлана Ковальова, Лариса Мазур, Олександра Нелюбіна

Національний університет харчових технологій, м. Київ

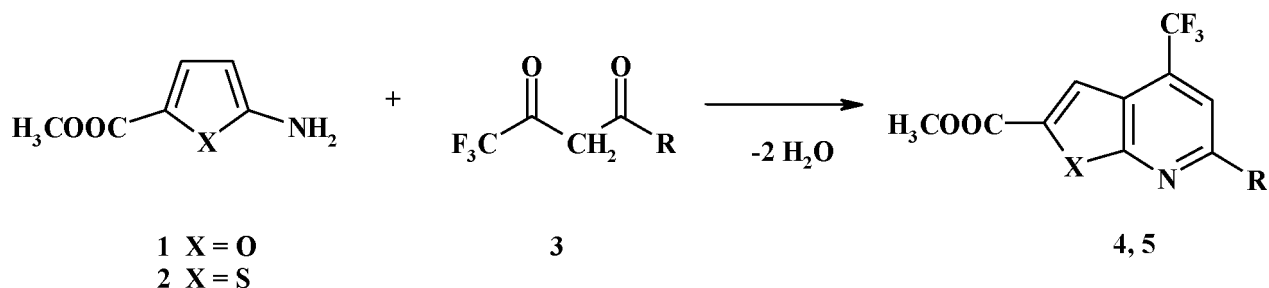
sval\_kov@ukr.net

**Вступ.** Багато похідних гетероциклічних сполук виявляють біологічну активність, тому дослідження, спрямовані на розробку простих методів їх синтезу, не втрачають актуальності. С-функціоналізовані амінопохідні електронозбагачених гетероциклів є перспективними вихідними сполуками для одержання на їх основі функціоналізованих складних гетероциклічних систем. Метиллові естери гетероциклічних карбонових кислот, що містять аміногрупу, вивчалися в реакціях гетероциклізації з 4,4,4-трифлуоро-3-оксобутанонами з метою синтезу анельованих похідних піридину.

**Матеріали і методи:** заміщені амінопохідні тіофену і фурану, 4,4,4-трифлуоро-3-оксобутанон, лабораторні методи синтезу органічних сполук, ЯМР спектроскопія.

**Результати.** Електроноакцепторний вплив трифлуорометильної групи сприяє підвищенню часткового позитивного заряду на С-атомі карбонільної групи у С<sup>2</sup>-положенні дикетону. Потужний електронодонорний ефект аміногрупи, замісника першого роду, біля С<sup>2</sup>-атома гетероциклу підвищує реакційну здатність С<sup>3</sup>-атома по відношенню до електрофільних реагентів. Встановлено, що амінопохідні С<sup>5</sup>-заміщених фурану (1) і тіофену (2) реагують з 4,4,4-трифлуоро-3-оксобутанонами з утворенням конденсованих систем фуранопіридину (3) і тіоєнопіридину (4). Реакції відбуваються при нагріванні відповідних реагентів у середовищі оцтової кислоти. Моніторинг хімічних перетворень проводили методом тонкошарової хроматографії на пластині. Вихід продукту реакції становить 75 — 95%.

Одержані речовини є стійкими за звичайних умов і виявляють ароматичний характер, про що свідчать дані спектроскопії ЯМР <sup>1</sup>H і <sup>13</sup>C.



**III Всеукраїнська науково-практична конференція “Актуальні проблеми хімії та хімічної технології”, 21 – 22 листопада 2018 р.**

---

Метиллові естери (**4**, **5**) послідовними реакціями лужного гідролізу і нейтралізації були перетворені на гетероциклічні карбонові кислоти. На стадії нейтралізації використовували лимонну кислоту замість неорганічних кислот, здатних протонувати піридинове кільце з утворенням водорозчинних солей. У структурі одержаних кислот є фармакофорні групи, тому ці сполуки можуть бути використані як вихідні реагенти для синтезу нових біологічно активних сполук.

**Висновки.** Запропонований метод синтезу анельованих піридинів є простим, одностадійним і базується на використанні доступних реагентів. Відомо, що багато заміщених похідних піридину виявляють біологічну активність, тому розробка і вивчення нових методів їх синтезу є актуальними.

### **Література**

1. Ковалёва С. А. 1,2-Дигидропиразоло(тиено)-1λ<sup>5</sup>-[2,4,1]-диазафосфи-нины / Ковалёва С. А., Чубарук Н. Г., Толмачев А. А., Пинчук А. М. // Химия гетероциклических соединений. -2001. - № 9. - С. 1287-1289.

2. Volochnyuk D. M. Electron-Rich Amino Heterocycles for Regiospecific Synthesis of Trifluoromethyl-Containing Fused Pyridines. // Synthesis. - 2003. - No. 10. - P.1531–1540.