

© Н.В.Иванова, 2006.

Н.В.Иванова

НОВЫЕ ПОДХОДЫ К СИНТЕЗУ 3,3'-БИСТРИАЗОЛОВ

Московская Академия Тонкой Химической Технологии им. Ломоносова
Москва, Россия

Аннотация

Был разработан наиболее простой способ синтеза 3,3'-бистриазолов, который может быть применен для получения библиотек для скрининга

Ключевые слова: 1,2,4-триазолы, димеры, бис-триазолы

E-mail: ivanova_n@chembridge.ru

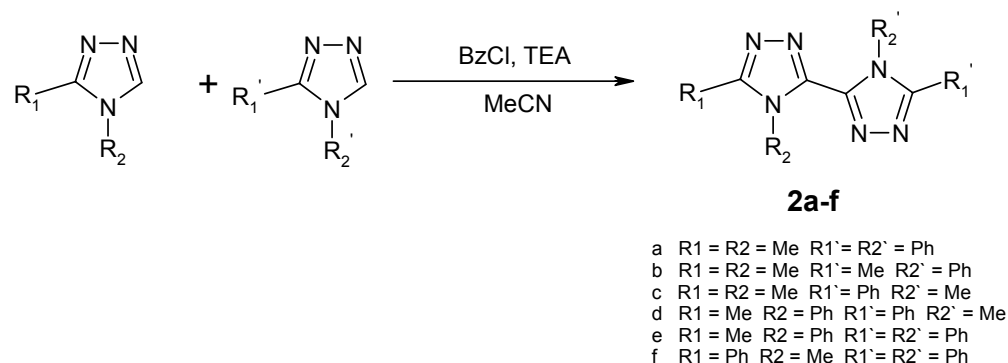
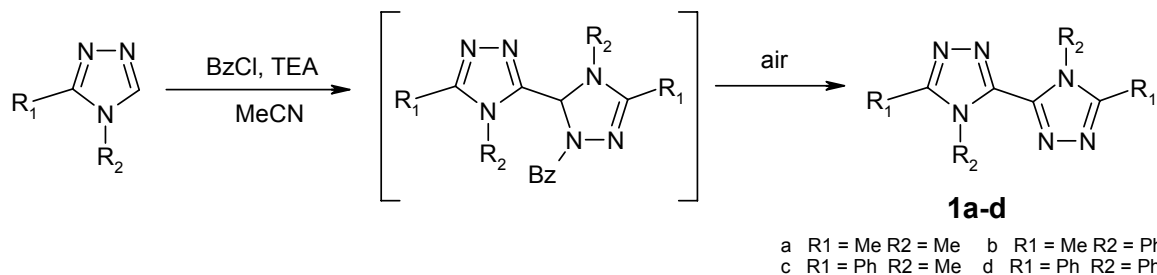
Большинство биологически активных соединений содержат пятичленные азотосодержащие гетероциклы. 1,2,4-триазольная часть присутствует, например, в известных противоастматических,¹ антивирусных (рибавирин),² противогрибковых (флуконазол),³ антибактериальных⁴ и снотворных (триазолам)⁵ препаратах. Поскольку о методах синтеза для такого типа веществ в литературе имеются ограниченные сведения, представляет интерес разработка новых эффективных путей их получения.

Известно, что имидазолы под действием хлорангидридов могут ацилироваться в положение 2, или в зависимости от условий давать димерные продукты.⁶ Нами было обнаружено, что триазолы в отличие от имидазолов дают в основном димерные продукты, причем для них характерна окислительная ароматизация в бис-триазолы. Как модельные соединения были выбраны триазолы, где представлены все варианты замещения ароматическими и алифатическими радикалами.⁷ Для R₁ – арильных заместителей продукты получаются с хорошими выходами, тогда как для алифатических R₁ в тех же условиях выход димеров умеренный. Кроме того была показана возможность получения несим-

метричных димеров при использовании этого подхода. Как и следовало ожидать, выход при этом низкий, однако продукты легко могут быть выделены при использовании препаративной LCMS. Этот подход является наиболее простым способом синтеза этого класса соединений и может быть применен для получения библиотек для скрининга.

Литература:

1. Naito, Y.; Akahoshi, F.; Takeda, S. *J. Med.Chem.* 1996, 39, 3019-3029.
2. De Clercq, E. *J. Clin. Virol.* 2004, 30, 115-133.
3. Collin, X.; Sauleau, A. *J. Biorg. Med. Chem. Lett.* 2003, 13, 2601-2605.
4. Papakonstantinou-Garoufalias, S. *Farmaco* 2002, 57, 973-977.
5. Hester, J. B.; Rudzik, A.D. *J. Med. Chem.* 1971, 14, 1078-1081.
6. Antonini I., et al, *J. Heterocycl. Chem.* 1978, 15, 1201; Bastiaansen L.A.M., et al., *Org. Synth., Coll.* 1990, 7, 287.
7. Ivanova N.V.; Sviridov S.I.; Shorshnev S.V.; Stepanov A.E. *J. Synthesis* 2006, 1, 156-160.



N.V.Ivanova

NOVEL APPROACH TO THE SYNTHESIS OF 3,3'-BISTRIAZOLES

Moscow Academia of Fine Chemical Technology named after Lomonosov
Moscow, Russia

The simplest method for the syntheses of 3,3'-bistriazoles were developed, which can be used to obtain libraries for screening.