

УДК 547.57:547.78+547.79

## УДОБНЫЙ ПОДХОД К ВВЕДЕНИЮ АЗОЛИЛЬНЫХ ФРАГМЕНТОВ В ПОЛОЖЕНИЕ 5 ТИАЗОЛЬНОГО КОЛЬЦА

А.Г.Баля, А.Г.Белюга, В.С.Броварец, Б.С.Драч

Институт биоорганической химии и нефтехимии НАН Украины,  
02094, г. Киев, ул. Мурманская, 1. E-mail: drach@bpci.kiev.ua

*Ключевые слова: амидофенацилирующие реагенты; тиобензамид; 5-ациламино-1,3-тиазолы и родственные имидоилхлориды; замещенные 5-азолил-1,3-тиазолы*

**При последовательной обработке доступных амидофенацилирующих реагентов тиобензамидом, а затем пентахлоридом фосфора легко получают производные 2,4-диарил-1,3-тиазолов с имидоилхлоридной группировкой в положении 5 гетероциклического кольца, которые оказались пригодными для синтеза ряда замещенных 5-азолил-1,3-тиазолов.**

**A SUITABLE METHOD OF AZOLYL FRAGMENTS ADDING TO THE POSITION 5 OF THIAZOL RING**  
A.G.Balya, A.G.Belyuga, V.S.Brovarets, B.S.Drach

**While continuously treating the accessible amidophenacylating reagents by thiobenzamide and then with phosphorus pentachloride the derivatives of 2,4-diaryl-1,3-thiazole with imidoylchloride grouping in position 5 of heterocyclic ring, which appeared to be suitable for the synthesis of the substituted 5-azolyl-1,3-thiazoles, are easily obtained.**

**ЗРУЧНИЙ ПІДХІД ДО ВВЕДЕННЯ АЗОЛІЛЬНИХ ФРАГМЕНТІВ У ПОЛОЖЕННЯ 5 ТІАЗОЛЬНОГО КІЛЬЦЯ**

**А.Г.Баля, О.Г.Белюга, В.С.Броварець, Б.С.Драч**

**При послідовній обробці доступних амідофенацилюючих реагентів тиобензамідом, а потім пентахлоридом фосфору легко одержують похідні 2,4-діарил-1,3-тіазолів з імідоїлхлоридним угрупованням у положенні 5 гетероциклічного кільця, які виявились придатними для синтезу ряду заміщених 5-азоліл-1,3-тіазолів.**

Доступные амидофенацилирующие реагенты 1, которые легко получают из продуктов присоединения амидов карбоновых кислот к фенолгликолю [1, 2], вполне направленно вступают в реакцию Ганча [2, 3], что использовано, в частности, для препаративного получения 5-ациламино-2,4-дифенил-1,3-тиазолов (2). Последние, как показано на схеме, при обработке пентахлоридом фосфора превращаются в соответствующие тиазолы 3 с имидоилхлоридной группировкой в положении 5 кольца, которые оказались пригодными для синтезов ряда других 5-функциональнозамещенных тиазолов 4-6 и продуктов их дальнейших циклизаций 7-12. В результате несложных и вполне тривиальных превращений: (3)→(4)→(7), (3)→(4)→(10)→(11), (3)→(5)→(8) и (3)→(6)→(9)→(12) в положение 5 тиазольного кольца без особых затруднений удалось ввести ряд азолильных фрагментов, которые относятся к системам 1Н-имидазола, 1Н-тетразола и 2Н-5-имино-1,2,4-тиадиазола. Особый интерес представляет циклоконденсация амидинов 4 с амидофенацилирующими реагентами, позволяющая получать такие производные 5-(имидазол-1-ил)-1,3-тиазола, которые содержат у центра С<sup>5</sup> имидазолильного фрагмента

различные ациламинные остатки или первичную аминогруппу. Для осуществления деацилирования (10)→(11) особенно пригодны те представители соединений 10, которые содержат у экзотического атома азота ацетильный остаток или карбобензоксигруппу. В первом случае деацилирование протекает при нагревании с 10%-ным раствором хлороводорода в водном этаноле, а во втором — карбобензоксигруппа отщепляется уже при 20°C в присутствии насыщенного раствора бромоводорода в уксусной кислоте [4].

В заключение отметим, что строение всех типов соединений, приведенных на схеме и в табл. 1, не вызывает сомнения, поскольку подтверждено комплексным спектральным и химическим исследованием. Так, циклизация (4)→(7) сопровождается исчезновением первичной аминогруппы, а деацилирование (10)→(11) приводит к её появлению, что действительно удалось подтвердить при помощи ИК- и ЯМР-<sup>1</sup>Н спектров (см. табл. 2). Кроме того, в ИК-спектрах продуктов взаимодействия имидоилхлоридов 3 с азидом натрия отсутствуют интенсивные полосы в области 1900–2300 см<sup>-1</sup>, что свидетельствует об участии азидогруппы в образовании тетразольного кольца.

Таблица 1

Характеристики 5-ациламино-2,4-дифенил-1,3-тиазолов 2 и продуктов их превращений 3,4,6-12

Соединение	Ar	R	Брутто-формула	Выход, %	Т.пл., °С (растворитель)	Найдено, %		Вычислено, %	
						N	S	N	S
2а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>22</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub>	79	173-174 (бензол)	8,09	9,08	7,86	8,99
2б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>23</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub>	85	199-200 (бензол)	7,30	8,35	7,56	8,65
3а*	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> ClN <sub>2</sub> S	89	152-154 (гексан)	7,26	8,40	7,47	8,55
3б**	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>23</sub> H <sub>17</sub> ClN <sub>2</sub> S	84	146-148 (гексан)	7,00	8,02	7,20	8,24
4а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> S	67	161-162 (CH <sub>3</sub> CN)	11,20	8,50	11,82	9,02
4б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>23</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> S	87	159-160 (CH <sub>3</sub> CN)	11,25	8,47	11,37	8,67
6а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>30</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	73	152-154 (CH <sub>3</sub> CN)	10,93	12,52	11,10	12,70
6б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>31</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	75	162-163 (CH <sub>3</sub> CN)	10,29	12,05	10,80	12,36
7а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>30</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> S	56	227-228 (ДМФА-CH <sub>3</sub> CN)	9,03	6,93	9,22	7,03
7б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>31</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> S	63	216-217 (AcOH)	8,83	6,80	8,94	6,82
8а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> N <sub>5</sub> S	74	145-146 (этанол)	18,31	8,37	18,35	8,40
8б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>23</sub> H <sub>17</sub> N <sub>5</sub> S	68	137-138 (этанол)	17,09	8,04	17,70	8,10
9а***	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>30</sub> H <sub>23</sub> BrN <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	91	208-210 разл. (нитрометан)	9,48	10,92	9,60	10,99
9б****	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>31</sub> H <sub>25</sub> BrN <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	87	214-216 разл. (нитрометан)	9,58	10,97	9,37	10,73
10а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>37</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	59	147-148 (этанол)	9,68	5,51	9,74	5,58
10б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>38</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	65	160-161 (этанол)	9,29	5,36	9,51	5,44
10в	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	C <sub>38</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	51	>250 (ДМФА-CH <sub>3</sub> CN)	9,45	5,33	9,51	5,44
10г	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	C <sub>39</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	53	191-192 (ДМФА-CH <sub>3</sub> CN)	9,09	5,25	9,29	5,32
10д	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>32</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	60	149-150 (этанол)	10,78	6,19	10,93	6,25
10е	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>33</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>5</sub>	57	151-152 (этанол)	10,58	5,95	10,62	6,00
10ж	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub> O	C <sub>32</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	62	209-210 (этанол)	10,53	6,00	10,60	6,06
10з	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub> O	C <sub>33</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	53	202-203 (этанол)	10,23	5,85	10,32	5,90
10и	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> O	C <sub>38</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	58	162-163 (этанол)	9,15	5,24	9,26	5,30
10к	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> O	C <sub>39</sub> H <sub>30</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	54	189-190 (этанол)	9,00	5,11	9,05	5,18
11а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>30</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> S	63*****	246-248 (этанол)	11,79	6,78	11,90	6,81
11б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>31</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> S	71*****	237-238 (этанол)	11,43	6,10	11,56	6,16
12а	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-	C <sub>30</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	83	225-227 разл. (ДМФА-CH <sub>3</sub> CN)	11,05	12,65	11,14	12,75
12б	4-CH <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-	C <sub>31</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> S <sub>2</sub>	81	180-182 (ДМФА-CH <sub>3</sub> N)	10,72	12,34	10,84	12,41

\* Найдено, %: Cl - 9,40. Вычислено, %: Cl - 9,45.

\*\* Найдено, %: Cl - 9,05. Вычислено, %: Cl - 9,11.

\*\*\* Найдено, %: Br - 14,54. Вычислено, %: Br - 13,69.

\*\*\*\* Найдено, %: Br - 14,68. Вычислено, %: Br - 13,37.

\*\*\*\*\* Выход по способу а.

К тому же превращения (4)→(7), (5)→(8) и (6)→(9) — частные случаи хорошо известных циклизаций, которые изучены ранее на многих других примерах, что существенно облегчает идентификацию ряда замещённых 5-азолил-1,3-тиазолов 7-12, представленных на схеме.

#### Экспериментальная часть

ИК-спектры новых соединений получали на спектрометре Specord M-80 в таблетках с KBr, а спектры ЯМР <sup>1</sup>H записывали на спектрометре Varian VXR-300 в растворе ДМСО-d<sub>6</sub> с ТМС в качестве внутреннего стандарта. Константы, выходы и элементные анализы новых соединений

приведены в табл. 1, а данные спектров ЯМР <sup>1</sup>H — в табл. 2.

**N-(1-Хлорфенацил)амиды карбоновых кислот (1а,б)** были синтезированы по методике, описанной в работе [2].

**5-Ациламино-2,4-дифенил-1,3-тиазолы (2а,б).** К теплому раствору 0,1 Моль одного из соединений 1а,б в 120 мл безводного тетрагидрофурана добавляли раствор 13,72 г (0,1 Моль) тиобензамида в 120 мл ТГФ, желтый раствор оставляли на 12 ч, растворитель упаривали в вакууме, добавляли 200 мл безводного метанола и кипятили 1 ч, метанол упаривали в вакууме, остаток обрабатывали 300 мл насыщенного водного раствора би-

Таблица 2

Данные ЯМР  $^1\text{H}$  спектров для синтезированных соединений

Соединение	Спектр ЯМР $^1\text{H}$ , $\delta$ , м.д. (DMCO-d <sub>6</sub> )
4а	7,18-8,14 м (17H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , NH <sub>2</sub> )
4б	2,39 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 7,19-8,13 м (16H, 2C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> , NH <sub>2</sub> )
7а	7,24-8,03 м (21H, CH, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
7б	7,04-8,02 м (20H, CH, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
8а	7,11-8,09 м (15H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
8б	2,30 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 7,16-8,08 м (14H, 2C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
10а	7,18-8,00 (25H, 5C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 10,71 ш.с (1H, NH)
10б	2,23 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 6,96-7,96 м (24H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 10,56 ш.с (1H, NH)
10в	2,34с (3H, CH <sub>3</sub> ), 7,17-8,00 м (24H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 10,57 ш.с (1H, NH)
10г	2,25 с, 2,35 с (6H, 2CH <sub>3</sub> ), 6,96-7,97 м (23H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , 2C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 10,82 ш.с (1H, NH)
10д	2,03 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 7,14-8,04 м (20H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 10,06 ш.с (1H, NH)
10е	2,01 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 2,23 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 6,95-8,05 м (19H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 10,01 ш.с (1H, NH)
10ж*	3,44 с, 3,65 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 7,15-8,05 м (20H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 9,39 ш.с, 9,60 ш.с (1H, NH)
10з*	2,23 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 3,40 с, 3,63 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 6,95-8,05 м (19H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 9,36 ш.с, 9,57 ш.с (1H, NH)
10и*	5,03-5,23 м (2H, CH <sub>2</sub> ), 7,16-8,03 м (25H, 5C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> ), 9,45 ш.с; 9,75 ш.с (1H, NH)
10к*	2,22 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 5,02-5,22 м (2H, CH <sub>2</sub> ), 6,95-8,02 м (24H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ), 9,40 ш.с
11а	5,37 ш.с (2H, NH <sub>2</sub> ), 7,14-8,10 м (20H, 4C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> )
11б	2,22 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 5,17 ш.с (2H, NH <sub>2</sub> ), 6,98-8,06 м (19H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
12а**	2,14 с, 2,43 с (3H, CH <sub>3</sub> ), 6,32-8,23 м (19H, 3C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
12б**	2,12 с, 2,27 с, 2,33 с, 2,42 с (6H, 2CH <sub>3</sub> ), 6,31-8,21 м (18H, 2C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> , 2C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )

\* Удвоенность сигналов связана с заторможенностью вращения вокруг связи NH-C(O)OR в ациламидном остатке.

\*\* Смесь син- и анти-изомеров ~ 1:1.

карбоната натрия, выпавший осадок отфильтровывали, промывали водой, сушили в вакуум-эксикаторе над пентаоксидом фосфора и соединение 2а или 2б перекристаллизовывали из бензола.

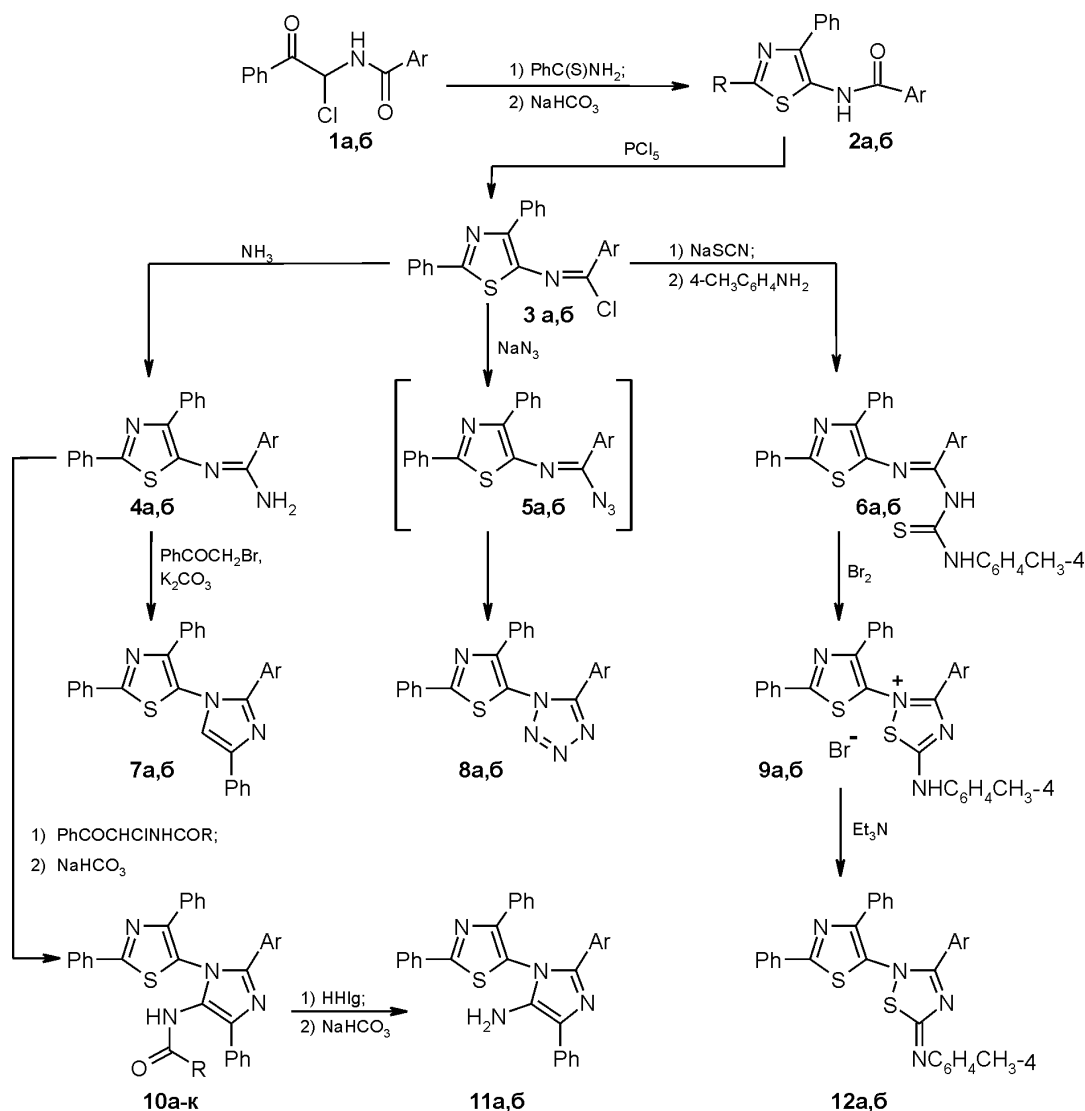
**N-(2,4-Дифенил-1,3-тиазол-5-ил)бензимидаилхлорид (3а) и N-(2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-4-метилбензимидаилхлорид (3б).** Смесь 0,035 Моль одного из соединений 2а,б и 8,76 г (0,042 Моль) пентахлорида фосфора в 100 мл безводного бензола кипятили 0,5 ч до прекращения выделения хлороводорода. Полученный раствор охлаждали, насыщали безводным сернистым газом для удаления остатков пентахлорида фосфора, летучие вещества удаляли в вакууме, твердый остаток обрабатывали абсолютным гексаном, отфильтровывали, высушивали в вакууме и соединения 3а,б очищали кристаллизацией. Для дальнейших превращений соединения 3а,б использовали без дополнительной очистки.

**N-(2,4-Дифенил-1,3-тиазол-5-ил)бензамидин (4а) и N-(2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-4-метилбензамидин (4б).** К суспензии 0,01 Моль имидоилхлорида 3а или 3б в 15 мл диоксана добавляли раствор 0,68 г (0,04 Моль) аммиака в 80 мл диоксана, смесь оставляли на 12 ч при 20–25°C, хлорид аммония отфильтровывали, к фильтрату добавляли 250 мл воды, выпавший осадок отфильтровывали и соединения 4а,б очищали кристаллизацией.

**1-[(N-2,4-Дифенил-1,3-тиазол-5-ил)бензимидаил]-3-п-толилтиомочевина (6а) и 1-[(N-2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-4-метилбензимидаил]-3-п-толилтиомочевина (6б).** К суспензии 0,001 Моль имидоилхлорида 3а или 3б в 30 мл безводного ацетонитрила добавляли 0,08 г (0,001 Моль) безводного роданида натрия. Смесь перемешивали 8 ч при 20–25°C и 8 ч при 70°C, охлаждали, добавляли 100 мл воды, осадок отфильтровывали, высушивали, суспендировали в 30 мл безводного ацетонитрила и добавляли 0,11 г (0,001 Моль) п-толуидина. Смесь нагревали 8 ч при 70°C, охлаждали до комнатной температуры и обрабатывали 100 мл воды. Выпавший осадок отфильтровывали, высушивали и соединения 6а,б очищали кристаллизацией.

**2,4-Дифенил-5-(2-арил-4-фенилимидазол-1-ил)-1,3-тиазолы (7а,б).** Смесь 0,0025 Моль одного из соединений 4а,б, 0,41 г (0,003 Моль) безводного карбоната калия и 0,55 г (0,00275 Моль) бромцетифенона в 20 мл абсолютного диоксана кипятили 10 ч. Смесь охлаждали, обрабатывали 100 мл воды, выпавший осадок отфильтровывали, высушивали и соединения 7а,б очищали кристаллизацией.

**1-(2,4-Дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-5-арил-1Н-тетразолы (8а,б).** Суспензию 0,0035 Моль соответствующего имидоилхлорида 3а или 3б и 0,27 г (0,0042 Моль) азидата натрия в 50 мл безводного



В соединениях 1-9, 11, 12: Ar = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>(а), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>(б);

в соединениях 10: Ar = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>(а, в, д, ж, и), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>(б, г, е, з, к);

R = C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>(а, б), 4-CH<sub>3</sub>C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>(в, г), CH<sub>3</sub>(д, е), CH<sub>3</sub>O(ж, з), C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>CH<sub>2</sub>O (и, к).

Схема

ацетонитрила перемешивали при комнатной температуре 20-25 °C, осадок отфильтровывали, к фильтрату добавляли 100 мл воды, осадок отфильтровывали, высушивали и очищали кристаллизацией.

**3-Арил-2-(2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-5-п-толуидино-1,2,4-тиадиазолий бромиды (9а,б).** К раствору 0,001 Моль одной из тиомочевин ба или бб в 30 мл хлороформа при перемешивании добавляли по каплям раствор 0,16 г (0,001 Моль) брома в 20 мл хлороформа, смесь перемешивали 2 ч, хлороформ удаляли в вакууме, остаток обрабатывали 20 мл этанола, отфильтровывали, высушивали и соединения 9а,б очищали кристаллизацией из нитрометана.

**2-Арил-5-ациламино-1-(2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-4-фенил-1H-имидазолы (10а-к).** К теплому раствору 0,0025 Моль одного из соединений 4а или 4б в 10 мл безводного тетрагидрофурана до-

бавляли раствор 0,0025 Моль N-(1-хлорфенил) амида соответствующей кислоты [2] в 20 мл абсолютного тетрагидрофурана, оставляли на 12 ч, растворитель упаривали в вакууме, остаток смешивали с 20 мл безводного метанола и кипятили 1 ч. Метанол удаляли в вакууме, остаток обрабатывали 100 мл насыщенного водного раствора бикарбоната натрия, осадок отфильтровывали, высушивали в вакуум-эксикаторе над пентаоксидом фосфора и соединения 10а-к очищали кристаллизацией.

ИК-спектр соединения, ν, см<sup>-1</sup>: 10а, 1670 (C=O), 3200-3400 (NH<sub>ассоц.</sub>); 10б, 1650 (C=O), 3150-3460 (NH<sub>ассоц.</sub>); 10д, 1710 (C=O), 3070-3320 (NH<sub>ассоц.</sub>).

**5-Амино-2-арил-1-(2,4-дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-4-фенил-1H-имидазолы (11а,б).** Способ а. К 5 мл насыщенного раствора безводного бромоводорода в ледяной уксусной кислоте добавляли 0,005 Моль

одного из соединений 10и или 10к и оставляли на 2 ч. Смесь обрабатывали 30 мл безводного диэтилового эфира, осадок отфильтровывали, промывали диэтиловым эфиром, сушили в вакууме и обрабатывали 50 мл насыщенного водного раствора карбоната натрия. Выпавший осадок отфильтровывали, высушивали и соединения 11а,б очищали кристаллизацией.

**Способ б.** К раствору 0,62 г (0,001 Моль) соединения 10е в 6 мл этанола добавляли 2,5 мл концентрированной соляной кислоты, смесь кипятили 2 ч, растворитель удаляли в вакууме, остаток обрабатывали 50 мл насыщенного водного раствора бикарбоната натрия, осадок отфильтровывали, высушивали и соединение 11б очищали кристаллизацией из этанола. Выход — 58%. Проба смешения двух образцов соединения 11б, полученных способами а и б, не давала депрессии температуры плавления. ИК-спектры этих образцов также были идентичными.

### Литература

1. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Кирсанов А.В. // *ЖОрХ.* — 1972. — Т. 8, №6. — С. 1224-1227.
2. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Кирсанов А.В. // *ЖОрХ.* — 1973. — Т. 9, №2. — С. 414-419.
3. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Сеница А.Д. // *ХГС.* — 1974. — №7. — С. 928-931.
4. Ben-Ishai D., Berger A. // *J. Org. Chem.* — 1952. — Vol. 17, №12. — P. 1564-1570.

Надійшла до редакції 31.10.2005 р.

**2-(2,4-Дифенил-1,3-тиазол-5-ил)-3-арил-5-п-толилимину-2Н-1,2,4-тиадиазолы (12а,б).** К суспензии 0,001 Моль одного из соединений 9а или 9б в 30 мл этанола при перемешивании добавляли 0,1 г (0,001 Моль) триэтиламина, смесь оставляли при 20-25°C на 2 ч, добавляли 100 мл воды, осадок отфильтровывали, высушивали и соединения 12а,б очищали кристаллизацией.

### Выводы

1. Показано, что доступные амидофенацилирующие реагенты типа PhCOCHClNHCOAg при последовательной обработке тиобензамидом и пентахлоридом фосфора превращаются в замещённые тиазолы с имидоилхлоридной группировкой в положении 5.

2. Найдено, что указанные выше имидоилхлориды можно использовать для введения различных азольных фрагментов к центру С<sup>5</sup> тиазольного кольца.