

СИНТЕЗ НОВИХ 7-БЕНЗИЛ-[1,2,3]ТРИАЗОЛО[1,5-*a*]ПІРАЗИНІВ

Тупичак М. А., Походило Н. Т., Обушак М. Д.

Львівський національний університет імені Івана Франка, Львів, Україна
tupychakmykola@gmail.com

1,2,3-Триазоли конденсовані з іншими гетероциклами активно досліджуються як потенційні біологічно активні сполуки. Серед них чільне місце займають 1,2,3-триазоли анельовані до шестичленних азагетероциклів, зокрема [1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразини. За останні 5 років розроблено значну кількість синтетично різних підходів до синтезу [1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразинів та їхніх похідних, зокрема, з застосуванням мультикомпонентних та тандемних реакцій, про що йдеться в недавньому огляді [1]. Проте більшість розроблених протоколів передбачає проведення кілька стадій з виділенням та очисткою проміжних продуктів, або використання дорогих чи специфічних каталізаторів, тому розробка нових методів отримання [1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразинів залишається актуальною задачею.

α -Азидокислоти та їхні похідні є зручними прекурсорами у синтезі лікоподібних сполук. α -Азидокислоти є синтетично доступними і можуть бути легко отримані в реакціях діазотрансферу із відповідних α -амінокислот, або в ході аніонарилювання акрилатів за Маєрвейном. В нашому дослідженні ми застосували 3-арил-2-азидопропанові кислоти для синтезу заміщених [1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразинових систем 2-5. З α -азидокислот **1** через утворення відповідних пропаргіл амідів, з наступною внутрішньомолекулярною циклізацією Х'юзена були отримані 4,5-дигідро-[1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразин-6(7*H*)-они **2** з задовільними виходами. За іншим синтетичним маршрутом, в реакції міжмолекулярної циклізації Х'юзена α -азидокислот **1** з диетиловим естером ацетелендикарбонової кислоти та наступною циклізацією, було синтезовано 4,6-диоксо-4,5,6,7-тетрагідро-[1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразин-3-карбоксилати **3**. Зрештою, досліджено пост-Угрі перетворення для синтезу [1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразин-4-карбоксамідів. Взаємодія α -азидокислот **1**, пропаргіл аміну, альдегідів та ізонітрилів веде до утворення лінійних адуктів Угі, що можуть зазнавати внутрішньомолекулярної циклізації Х'юзена з утворенням заміщених 4,5-дигідро-[1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразин-6(7*H*)-онів **4** з виходами близькими до кількісних. Альтернативно, застосування в реакції Угі 2-бromo-3-фенілакрилальдегіду, веде до утворення адуктів, котрі за участі триетиламіну циклізуються з утворенням заміщених 3-феніл-4,5-дигідро-[1,2,3]триазоло[1,5-*a*]піразин-6(7*H*)-онів **5**.

