

Схема 1.

тезированы новые 1,3-бензодиазолы, 1,2,3-бензотриазолы и 2,1,3-бензотиа/селенадизолы (некоторые примеры приведены на схеме 1) и изучена их противораковая активность, в том числе в сравнении с ранее полученными 1,4-бензодиазанами (хиноксалинами) [5]. Обнаружено, что синтезированные вещества в низких концентрациях (0,20–25 мМ) индуцируют апоптоз раковых клеток человека HepG2 (рак печени), Hep2 (рак гортани) и U937 (лейкоз) как в пер-

вые, так и во вторые сутки эксперимента (некоторые примеры, относящиеся к 1,3-бензодиазолам, приведены на рисунке).

Примечательно, что высокой противораковой активностью обладают и исходные полигалогенированные 1,2-диаминобензолы.

Апоптоз клеток Hep2 под действием 3,4,5,6-тетрафтор-1,3-бензодиазола (вверху слева), его 2-метил-6-хлор- (вверху справа) и 2-трифтометил-6-хлор- (внизу) производных.

### Список литературы

1. Prakash Reddy V. // *Organofluorine Compounds in Biology and Medicine*. Elsevier, 2015.
2. Wang J., Sanchez-Rosello M., Acena J.L., Del Pozo C., Sorochinsky A.E., Fustero S., Soloshonok, V.A., Liu H. // *Chem. Rev.*, 2014.– 114.– 2432–2500.
3. Ford M.C., Ho P.S. // *J. Med. Chem.*, 2016.– DOI: 10.1021/acs.jmedchem5b00997.
4. Liang T., Neumann N.C., Ritter T. // *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2013.– 52.– 32.– 8214–8264.
5. Mikhailovskaya T.F., Makarov A.G., Selikhova N.Yu., Makarov A.Yu., Pritchina E.A., Bagryanskaya I.Yu., Vorontsova E.V., Ivanov I.D., Tikhova V.D., Gritsan N.P., Slizhov Yu.G., Zibarev A.V. // *J. Fluor. Chem.*, 2016.– 183.– 44–58.

## СИНТЕЗ НЕСИМЕРТИЧНЫХ ДИФЕНИЛАЦЕТИЛЕНОВ И ИСПОЛЬЗОВАНИИ ИХ В КЛИК-РЕАКЦИИ

К. Пудпади, М.А. Морозова

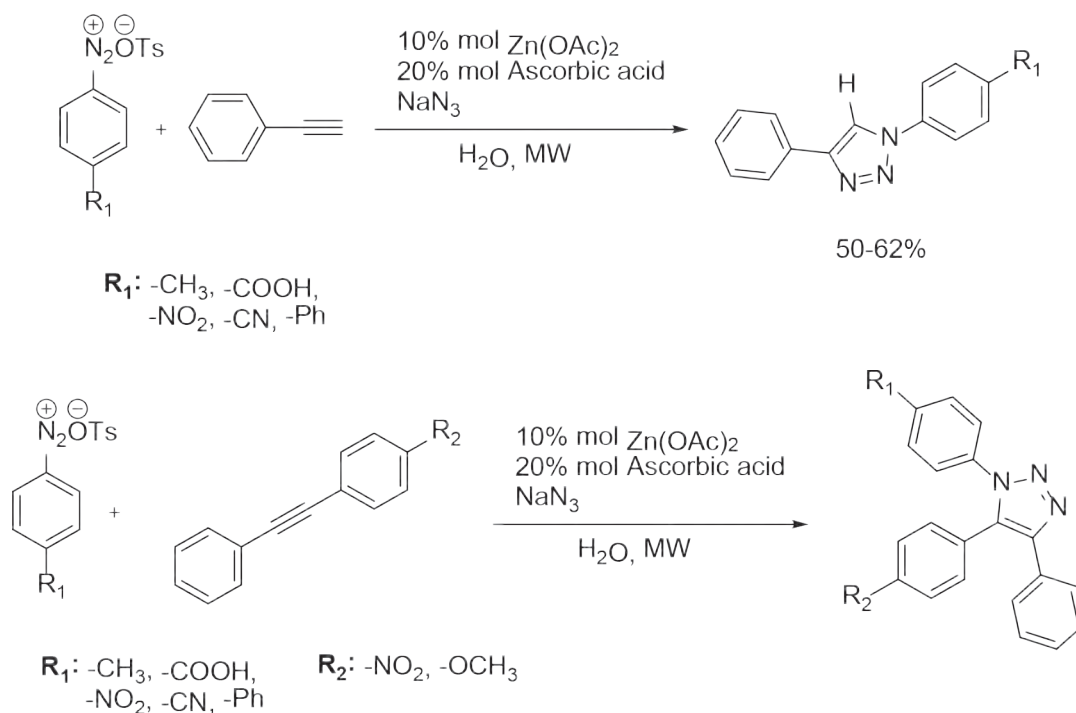
Научный руководитель – к.х.н, инженер-исследователь М.Е. Трусова

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, kittiya-aor@hotmail.com

1,4-замещенные-1,2,3-триазолы применяются во многих областях, например в фармацевтике [1] в качестве лекарственных препаратов, орга-

нической химии [2], материаловедении [3, 4], агрохимии [2] и т.д.

Существующие методы синтеза 1,4-заме-



**Схема 1.** 1,3-диплярная циклизация ароматических азидов с бифункциональными ацетиленами

щенные-1,2,3-триазолов предполагают использования Cu-катализаторов (на пример, Cu(OAc), CuSO<sub>4</sub>, наноматериалы и цеолиты содержащие в своей структуре медь) в среде органических или водно-органических растворителей (DMSO, DMF, THF [5–7]). Данные методы эффективны, однако имеется одно очень серьезное ограничение, а именно наличие «кислого» протона в структуре ацетилена. Кроме того, использование Cu-катализаторов влечет за собой необходимость отделения продукта реакции от катализаторов.

Нами разработан универсальный метод синтеза 1,4-замещенных-1,2,3-триазолов основанный на использовании Zn(OAc)<sub>2</sub> в воде. На примере фенилацетилена показано, что метод

имеет общий характер и во взаимодействия могут вступать различные арендиазоний тозилаты, содержащие как донорные, так и акцепторные заместители. Процесс протекает через промежуточное образование ароматических азидов. Кроме того, нами определено, что добавки аскорбиновой кислоты и СВЧ-облучение ускоряют процесс и время реакции составляет 2–3 часа.

Нами впервые показано, что в присутствии Zn(OAc)<sub>2</sub> позволяет провести сочетание и с бифункциональными ацетиленами (схема 1). В результате образуются соответствующие 1,4-замещенных-1,2,3-триазолы с высокими выходами

В результате мы разработали мягкий эффективный метод позволяющий синтезировать широкий ряд триазолов.

### Список литературы

1. Wang G.S., Mocharla V.P., Lin R.J., Phelps M.E., Kolb H.C., Tseng H.R. // *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2006. – №45. – 5276–5281.
2. Kumar D., Reddy V.B. // *Synthesis*, 2010. – №10. – 1687–1691.
3. Lutz J.F. // *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2007. – №46. – 1018–1025.
4. Zarei A. // *Tetrahedron Letters*, 2012. – №53. – 5176–5179.
5. Chen Y., Zhuo Z.J., Cui D.M., Zhang C. // *Journal of Organometallic Chemistry*, 2014. – №749. – 215–218.
6. Chassainget S., Sani Souna Sido A., Alix A., Kumarraja M., Pale P., Sommer J. // *Chem. Eur. J.*, 2008. – №14. – 6713–6721.
7. Tao C., Cui X., Li J., Liu A., Liu L., Guo Q. // *Tetrahedron Letters*, 2007. – №48. – 3525–3529.