

## ДИАЗОТИРОВАНИЕ-ИОДИРОВАНИЕ N-ОКСИДИРОВАННЫХ АМИНОГЕТЕРОЦИКЛОВ

Е.В. Романенко, А.А. Чудинов  
Научный руководитель – д.х.н. Е.А. Краснокутская

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, horanlena@yandex.ru

Иод содержащие гетероциклы представляют значительный интерес для органического синтеза. Они могут быть использованы в синтезе мономеров для современных полимерных материалов, лигандов для металлокомплексного катализа [1, 2] биологически активных веществ [3], а так же как полупродукты в реакциях C–C сочетания [2, 4].

Методы синтеза иодгетероциклов весьма ограничены. В настоящее время существует несколько принципиальных подходов для введения иода в молекулу гетероцикла – электрофильное иодирование, ипсо-замещение хлора или брома на иод или иододебромирование через предварительное металлизирование [5].

Одним из методов получения иодгетероциклов является реакция диазотирования-иодирования – синтетический прием, включающий последовательное диазотирование аминогетероцикла и замена диазо-группы на галоген. Однако синтез электрондефицитных иодгетероциклов значительно затруднен. Так, например, синтез иодгетероцикла из 3-аминопиридина посредством реакции диазотирования-иодирования проходит сравнительно легко. Тогда как, 2- и

4-аминопиридины, мало реакционноспособны в указанных превращениях в следствие дезактивирующего влияния протонированной формы пиридинового кольца [6].

В процессе исследования реакций диазотирования-иодирования, были рассмотрены и подобраны различные условия, в которых реакция протекает наиболее успешно. Так была предложена следующая схема синтеза (схема 1).

В последствии было предложено проводить реакцию диазотирования-иодирования с предварительным N-оксидированием аминопиридинов. Этот способ основан на способности N-оксидов влиять на распределение электронной плотности в цикле и увеличивать реакционную способность гетероциклов в реакциях замещения.

Реакция диазотирования-иодирования N-оксидированных аминопиридинов протекает в тех же условиях (схема 2).

Таким образом, была разработана новая методика диазотирования-иодирования с предварительным N-оксидированием в присутствии бутил нитрита и трифторметансульфокислоты в системе уксусная кислота/тетрагидрафур.

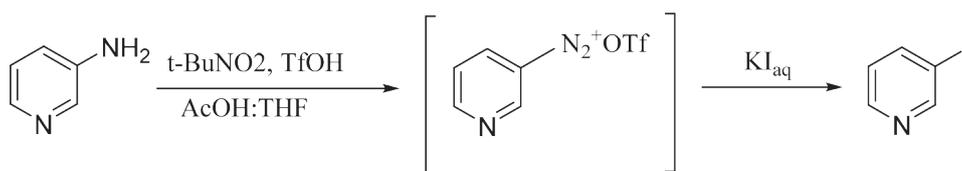


Схема 1.

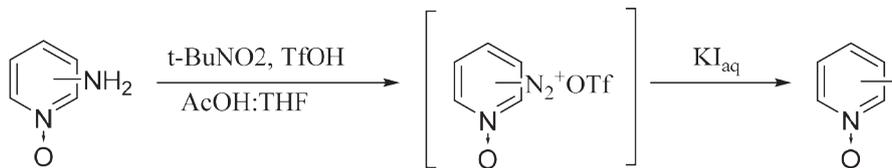


Схема 2.

### Список литературы

1. F.G. Njoroge, B. Vibulbhan, D.F. Rane, W.R. Bishop, J. Petrin, R. Patton, M.S. Bryant et al. // *J. Med. Chem.*, 1997. – №40. – P.4290–4301.
2. H. Abe, H. Machiguchi, S. Matsumoto, M. Inouye // *J. Org. Chem.*, 2008. – №73(12). – P.4650–4661.
3. X. Lu, J.L. Petersen, K.K. Wang // *J. Org. Chem.*, 2002. – №67. – P.5412–5415.

4. Handy S.T., Wilson T., Muth A. // *J. Org. Chem.*, 2007. – №72. – P.8496–8500.  
 5. Corcoran R.C., Bang S.H. // *Tetrahedron Lett.*, 1990. – №31. – №47. – P.6757–6758.  
 6. Suzuki H., Nonoyama N. // *Tetrahedron Lett.*, 1998. – №39. – №25. – P.4533–4536.

## ПОЛУЧЕНИЕ СЛОЖНЫХ ЭФИРОВ САЛИЦИНА И АЛИФАТИЧЕСКИХ КИСЛОТ

Д.А. Романова, Е.В. Степанова

Научный руководитель – к.х.н., старший преподаватель Е.В. Степанова

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
 634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, da.romanova.93@gmail.com

Осина обыкновенная обладает большим спектром полезных веществ, на ее основе изготавливаются масса средств, которые обладают противовоспалительными, жаропонижающими и мочегонными качествами. Такие полезные свойства осине придает набор различных фенолгликозидов, основных биологически активных ее компонентов [1].

Наиболее распространенным среди фенолгликозидов является салицин. Благодаря своим

антиоксидантным и противовоспалительным свойствам, салицин находит широкое применение в медицине: используется как индивидуальный фармпрепарат, так и в виде экстрактов [2].

Как известно, введение галогенов в фармпрепараты может значительно увеличивать и изменять биологическую активность [3]. Но и введение других функциональных групп играет не менее важную роль в изменении биологической активности соединений, так, например, сали-

