

## СИНТЕЗ N,N-ДИМЕТИЛПРОИЗВОДНЫХ АМИНОПИРИДИНОВ

М.И. Потапова

Научный руководитель – д.х.н., профессор Е.А. Краснокутская

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, [maripapotarova1994@mail.ru](mailto:maripapotarova1994@mail.ru)

N,N-диметилпроизводные аминопиридинов являются важными полупродуктами тонкого органического синтеза [1, 2], отдельные их представители имеют самостоятельный практический интерес. Так, 4-диметиламинопиридин (DMAP) широко используется в качестве катализатора [3].

Одним из основных методов получения N,N-диметиламинопиридинов является нуклеофильное ароматическое замещение галогенсодержащих пиридинов [4, 5].

Недавно нами были предложены удобные методы получения широкого ряда пиридилсульфонатов (трифлатов и тозилатов) через диазотирование аминопиридинов [6, 7]. Указанные соединения во многих реакциях могут выступать хорошей альтернативой галогенпроизводным пиридинов.

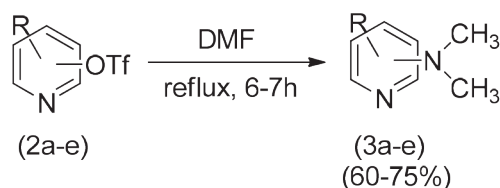
Целью данной работы было исследование препаративных возможностей пиридилтрифлатов и тозилатов в синтезе N,N-диметиламинопиридинов.

Мы впервые показали, что пиридилтрифлаты (2a–e) при простом кипячении в ДМФА превращаются в N,N-диметилзамещенные аминопиридины (схема 1).

Далее мы показали, что N,N-диметиламинопиридины (3a–e) могут быть получены в результате последователь-

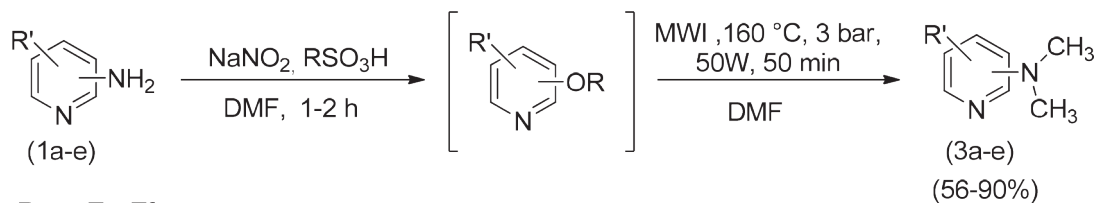
ного диазотирования аминопиридинов (1a–e) и замены сульфатной группы на группу NMe<sub>2</sub> в растворе ДМФА. Оказалось, что использование микроволнового облучения значительно уменьшает время реакции (схема 2) и обеспечивает хорошие (неоптимизированные) выходы целевых продуктов (3a–e).

Таким образом, было впервые показано, что пиридилтрифлаты и тозилаты могут выступать хорошей альтернативой галогенпроизводным пиридинов в синтезе N,N-диметиламинопиридинов. Предложен одnoreакторный метод получения N,N-диметиламинопиридинов через последовательное диазотирование – нуклеофильное замещение. В качестве исходных субстратов для этих превращений используются коммерчески доступные аминопиридины.



2a: R=H, 4-OTf	3a: R=H, 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2b: R=H, 2-OTf	3b: R=H, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2c: R=5-Br, 2-OTf	3c: R=5-Br, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2d: R=5-Cl, 2-OTf	3d: R=5-Cl, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
2e: R=5-NO <sub>2</sub> , 2-OTf	3e: R=5-NO <sub>2</sub> , 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

Схема 1.



R = p-Ts, Tf

1a: R'=H, 4-NH <sub>2</sub>	3a: R=H, 4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1b: R'=H, 2-NH <sub>2</sub>	3b: R=H, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1c: R'=5-Br, 2-NH <sub>2</sub>	3c: R=5-Br, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1d: R'=5-Cl, 2-NH <sub>2</sub>	3d: R=5-Cl, 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
1e: R'=5-NO <sub>2</sub> , 2-NH <sub>2</sub>	3e: R=5-NO <sub>2</sub> , 2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

Схема 2.

## Список литературы

1. Cheshire D.; Cladinggboel D.; Cooper M. et al. United states patent, AstraZeneca UK Limited - US6143751, 2000. – A1.
2. Chen Ch.; Wilcoxon K.M.; Huang Ch.Q. et al // *J. Med. Chem.*, 2004. – Vol.47. – №19. – P.4787–4798.
3. Hassner A. *e-EROS Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis, 4-Dimethylaminopyridine*, 2016. – P.1–6.
4. Lundgren R.J. ; Sapping-Kumankumah A.; // *Chem. Eur. J.*, 2010. – Vol.16. – №6. – P.1983–1991.
5. Kodimuthali A.; Mungara A.; Prasunamba P-L., Pal M. // *J. Braz. Chem. Soc.*, 2010. – Vol.21. – №8. – P.1439–1445.
6. Krasnokutskaya E.A.; Kassanova Ass. Zh.; Estaeva M.T.; Filimonov V.D. // *Tetrahedron Letters*, 2014. – №55. – P.3771–3773.
7. Kassanova, Ass. et al. // *Synthesis*, 2016. – №48. – P.256–262.

## НОВЫЕ РЕАКЦИИ БЕТУЛИНА С ПРОИЗВОДНЫМИ МОЧЕВИНЫ

П.В. Прасолов

Научный руководитель – к.х.н., ассистент Е.А. Мамаева

Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, chelovek105@mail.ru

В настоящее время к природным соединениям наблюдается повышенное внимание со стороны исследователей, фармакологов, специалистов фармотрасли. Лидирующие позиции в этом отношении занимают бетулин и его производные, обладающие целым набором полезных медико-биологических свойств: противовирусных, антисептических, антиоксидантных, противовоспалительных, а также активностью против ряда раковых клеток и возбудителей полиомиелита [1, 2].

Доступность сырьевой базы для получения бетулина и широкий спектр активности делают его ценным ключевым соединением в синтезе новых биологически активных веществ. Вслед-

ствие этого, становится актуальным развитие важного направления в современной органической химии – химической модификации природных пентациклических тритерпеноидов.

Несмотря на многочисленные исследования свойств бетулина, сообщения о прямой его модификации азотсодержащими веществами ограничены несколькими сообщениями [3, 4]. При этом мочевины широко используются в органическом синтезе в качестве превосходных реагентов для получения азотсодержащих соединений различных классов [5] и обладают ценными фармакологическими свойствами [6].

Поскольку, литературные сведения о реакциях бетулина с мочевиными отсутствуют, мы

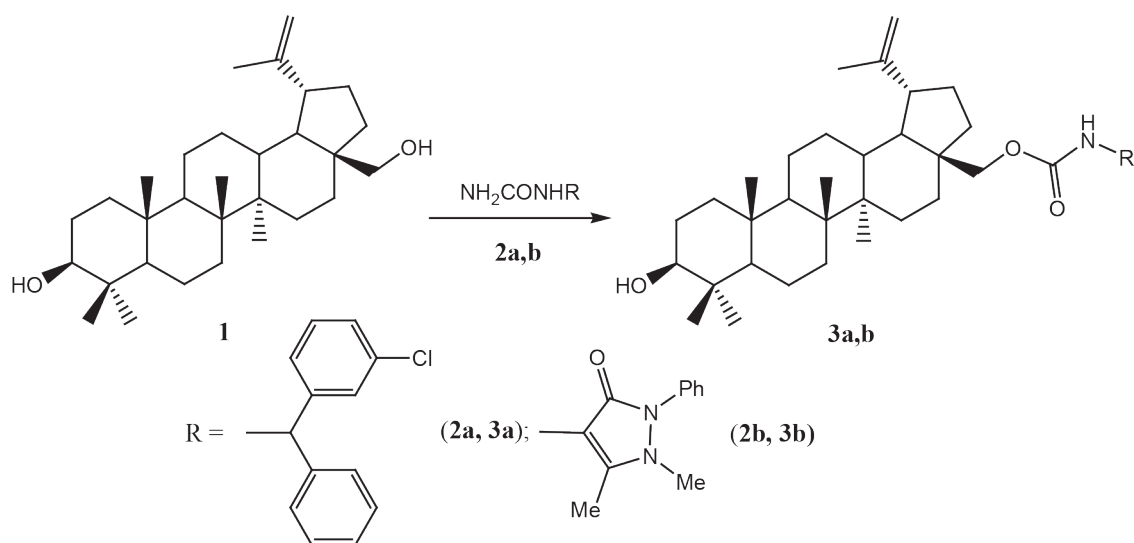


Схема 1.