

*Посвящается академику Олегу Николаевичу Чупахину
в связи с его 80-летием*

**Л. Н. Дианова¹, В. С. Берсенева¹, О. С. Ельцов¹,
Ж.-Д. Фан², В. А. Бакулев^{1*}**

РЕАКЦИИ ПРОИЗВОДНЫХ МАЛОНТИОАМИДА С АЗИДАМИ

Реакции первичных и третичных малонтиоамидов с арил- и сульфонлазидами, в зависимости от природы тиоамидов и азидов, могут протекать по трём направлениям: этоксикарбонилтиоацетамид взаимодействует с ариламидами с образованием этил-5-амино-1-арил-1,2,3-триазол-4-карбоксилатов, третичные тиоамиды циануксусной кислоты в реакции с ариламидами образуют 5-амино-1-арил-1,2,3-триазол-4-карботиоамиды, а в реакции с тозилазидом – 4-карбоксамидино-5-амино-1,2,3-тиадиазолы. Обсуждены предполагаемые механизмы обнаруженных превращений.

Ключевые слова: ариламиды, малонтиоамиды, 1,2,3-тиадиазолы, 1,2,3-триазолы, перегруппировки, циклоконденсация.

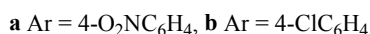
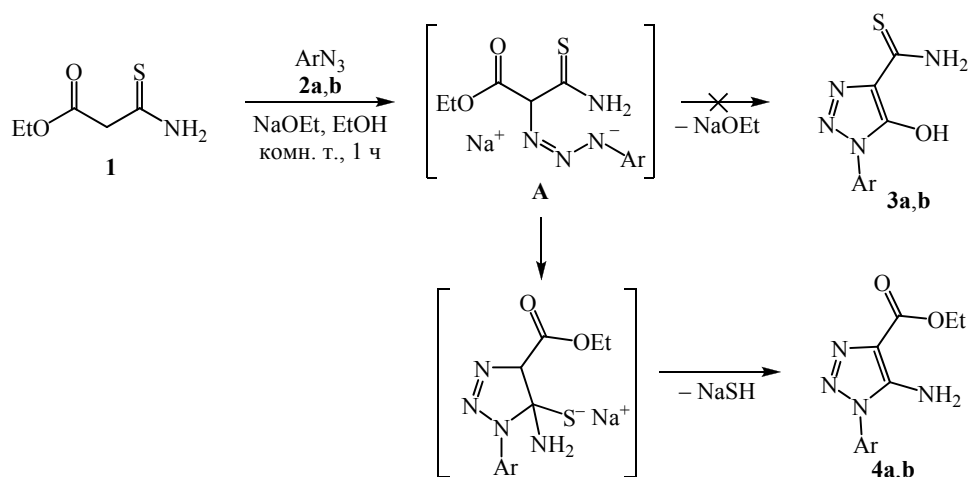
Способность 1,2,3-триазолов и 1,2,3-тиадиазолов к различным химическим превращениям, особенно к трансформациям и взаимным перегруппировкам, всегда привлекала внимание исследователей [1–9]. 1,2,3-Триазольный и 1,2,3-тиадиазольный циклы входят в структуру большого числа соединений, обладающих биологической активностью, что стимулирует интерес к синтезу новых производных этого ряда. 1,2,3-Триазольный цикл является структурной основой антибактериальных, противовоспалительных, гипотензивных препаратов, нейролептиков, ингибиторов ВИЧ, пестицидов [1, 2]. Среди производных 1,2,3-триазола обнаружены селективные ингибиторы протеазы ВИЧ-1 и гистондиацетилазы – перспективные противоопухолевые агенты [10–14]. Широкий спектр биологической активности свойственен и производным 1,2,3-тиадиазолов. Наиболее интересны с практической точки зрения препараты, обладающие противовирусной, гербицидной и фунгицидной активностью, средства защиты и регуляторы роста растений [6, 9, 15, 16].

Различают четыре основных метода синтеза 1,2,3-триазолов: конденсация аминов с α -дiazокарбонильными соединениями, циклизация бисгидразонов α -дикарбонильных соединений, циклоприсоединение азидов к замещённым ацетиленам и олефинам и взаимодействие азидов с СН-активными соединениями [1, 2]. В последнем случае конденсацией азидов (ароматических, алифатических, гетероциклических) и соединений с активной метиленовой группой в присутствии основания получают тризамещённые триазолы. В зависимости от характера активирующей группы реакции могут протекать либо как нуклеофильное присоединение карбаниона к азиду, либо по согласованному механизму как циклоприсоединение азидов к промежуточному олефину (енолу).

В литературе приведены многочисленные примеры реакции азидов с различными карбонил- и цианопроизводными уксусной кислоты, так называемая реакция Димрота [2, 14, 17–21]. При этом известен только один

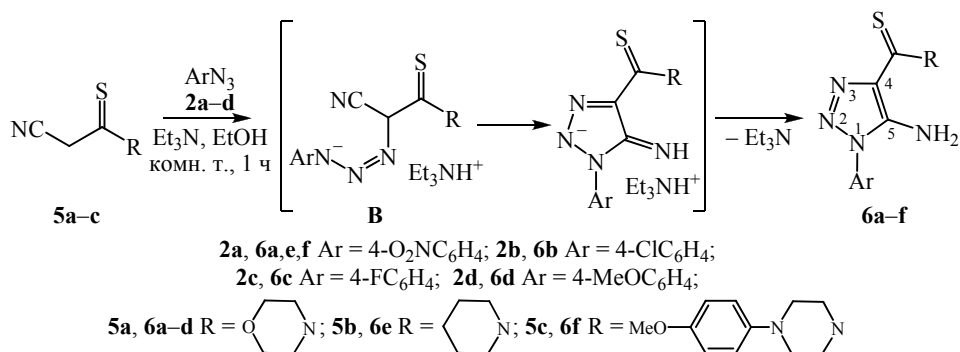
пример использования в данной реакции малонтиоамидов – циклизация цианотиоацетамида при взаимодействии с ариламидами, в котором тиоамидная группа остается неизменной [19]. Этот пример никоим образом не исчерпывает богатый химический потенциал тиоамидов, их способности взаимодействовать с разнообразными электрофильными реагентами, участвовать в разнообразных конденсациях [22] и перегруппировках [7–9].

С целью разработки новых методов синтеза 1,2,3-триазола и 1,2,3-тиадиазола путём вовлечения тиоамидной группы в реакцию с азидами мы исследовали реакции первичных и третичных тиоацетамидов с арил- и тозилзидами. На основании литературных данных [2] при взаимодействии этилового эфира 2-тиокарбамоилуксусной кислоты (**1**) с ариламидами **2a,b** в присутствии основания мы ожидали образования 1-арил-4-гидрокси-1,2,3-триазол-4-карботиоамидов **3a,b** в качестве результата реакции присоединения электрофильного азида к активной метиленовой группе с последующей циклоконденсацией промежуточного триазена **A** и элиминированием этилат-иона на последней стадии процесса.



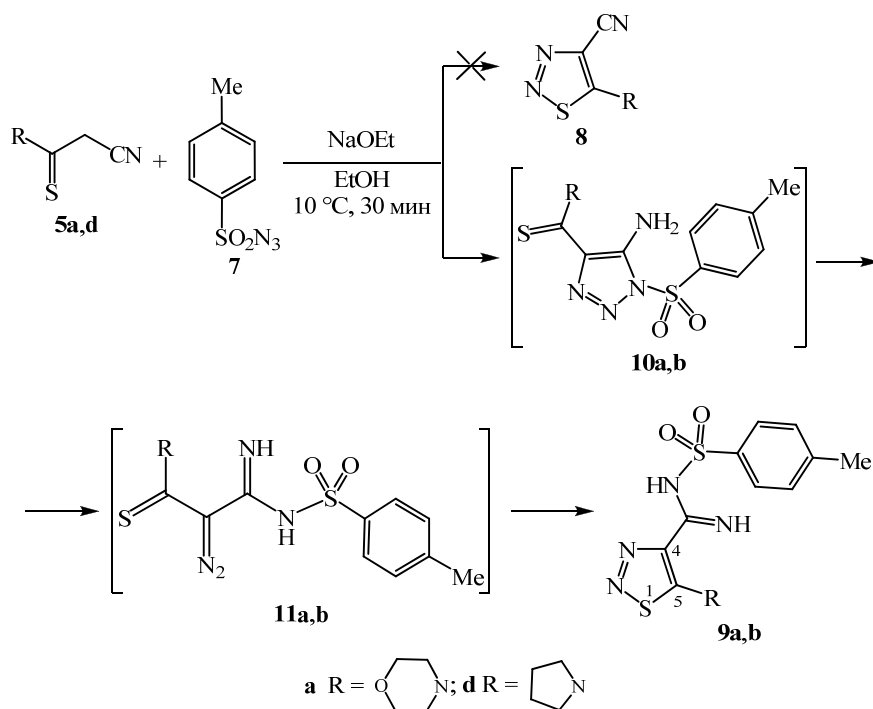
Вместо этого мы обнаружили, что реакция тиоамида **1** с азидами **2a,b** в присутствии этилата натрия при комнатной температуре протекает селективно с образованием другого типа соединений. Из реакционной смеси со средними выходами были выделены этил-5-амино-1-арил-1,2,3-триазол-4-карбоксилаты **4a,b**, строение которых установлено на основании данных ИК, ЯМР спектроскопии и масс-спектрометрии. В ИК спектре соединения **4a** зарегистрированы полосы валентных колебаний сложноэфирной группы C=O (1733 см⁻¹) и полосы аминогруппы (3447, 3276 см⁻¹). Сигналы протонов этильной группы и синглет протонов аминогруппы при 6.76 м. д. присутствуют в спектре ЯМР ¹H. Синтезы подобных 5-амино-1,2,3-триазол-4-карбоксилатов другими методами были описаны ранее [2, 23, 24]. По-видимому, взаимодействие эфира 2-тиокарбамоилуксусной кислоты **1** с ариламидами **2** протекает через внутримолекулярную конденсацию промежуточного триазена **A** с участием тиоамидной группы. Обнаруженная реакция представляет первый пример реакции Димрота, заключительной стадией которой является элиминирование гидросульфид-иона.

Реакции *N,N*-дизамещённых цианотиоацетамидов **5a–c** с ариламидами **2a–d** в присутствии триэтиламина при комнатной температуре также проходят селективно с образованием 1-арил-5-амино-1,2,3-триазол-4-карботиоамидов **6a–f**. Можно предположить, что в этом случае внутримолекулярная атака анионного центра на атоме азота триазена **B**, образующегося на первой стадии, проходит быстрее по электрофильному атому углерода цианогруппы по сравнению с атакой по тиаомидной группе.



Доказательство структуры триазолов **6a–f** проведено на основании анализа спектров ЯМР. Так, наличие тиаомидной группы подтверждается сигналом протонов аминогруппы в виде синглета при 7.30 м. д. в спектре ЯМР ¹H и характерным сигналом тиокарбонильного углерода при 184.6 м. д. в спектре ЯМР ¹³C.

Если реакции малонтиоамидов с ариламидами малоизвестны, то взаимодействие малонтиоамидов с сульфонилазидами широко используется для получения производных 1,2,3-тиадиазола [16]. Поэтому в реакции тиаомидов **5a,d** с тозилатом **7** в присутствии этилата натрия прежде всего можно было ожидать образования 5-аминопроизводных 1,2,3-тиадиазол-4-карбонитрила **8**.



Чтобы исключить возможные перегруппировки 1,2,3-тиадиазолов, реакцию проводили при пониженной температуре (10 °С). Однако в результате эксперимента были получены не ожидаемые 1,2,3-тиадиазол-4-карбонитрилы **8**, а производные *N*-тозил-1,2,3-тиадиазол-4-карбоксамидина **9a,b** с хорошими выходами (80 и 82% соответственно).

Со структурой *N*-тозилкарбоксамидина хорошо согласуются данные спектроскопии ЯМР ^1H и ^{13}C , а также масс-спектрометрии соединений **9a,b**. Спектр ЯМР ^1H соединения **9a** содержит сигналы протонов тозилного и морфолинового фрагментов, а также два синглета протонов NH при 8.39 и 9.16 м. д. В спектре ЯМР ^{13}C зарегистрированы сигналы атомов углерода метильной группы (20.9 м. д.), морфолинового (52.9 и 61.9 м. д.) и ароматического (126.2, 129.5, 139.0 и 141.8 м. д.) циклов, атома углерода амидиновой группы при 136.3 м. д. и двух атомов углерода 1,2,3-тиадиазольного цикла при 156.6 и 170.2 м. д. В пользу 1,2,3-тиадиазола, а не 1,2,3-триазол-4-карботиоамида **10a** свидетельствует также отсутствие сигнала атома углерода C=S тиоамидной группы в области 185 м. д. Значения химических сдвигов сигналов атомов углерода C-4 и C-5 1,2,3-тиадиазолов **9a,b** согласуются с данными спектроскопии ЯМР ^{13}C других производных 5-амино-1,2,3-тиадиазола [3, 4].

Окончательная идентификация 5-морфолино-*N*-тозил-1,2,3-тиадиазол-4-карбоксамидина (**9a**) была сделана с помощью двумерной спектроскопии ЯМР на основании результатов экспериментов HMBSC и HSQC. Так, в спектре HMBSC соединения **9a** характеристичными являются кросс-пики сигналов атома углерода C-5 (170.2 м. д.) и протонов морфолинового кольца (3.20–3.25 м. д.), а также корреляция сигналов атома углерода C-3 (136.3 м. д.) с протонами групп NH (8.39 и 9.16 м. д.) в амидиновом фрагменте. В спектре HSQC соединения **9a** зафиксированы кросс-пики всех сигналов углерода и протонов, имеющих прямое взаимодействие.

Вероятно, циклизация *N,N*-дизамещённых цианотиоацетамидов под действием тозилазида проходит как трёхступенчатый процесс: на первой стадии образуются 5-амино-1-тозил-1*H*-1,2,3-триазол-4-карботиоамиды **10a,b**, которые далее подвергаются двустадийной перегруппировке типа перегруппировки Корнфорта в 1,2,3-тиадиазол-4-карбоксамидины **9a,b** через промежуточные диазосоединения **11a,b**.

Таким образом, в настоящей работе показано, что в реакции азидов с производными тиоацетамида, в зависимости от природы исходных реагентов, реализуются различные типы гетероциклизации и происходит образование либо эфиров и тиоамидов 5-амино-1-арил-1,2,3-триазол-4-карбоновой кислоты, либо 4-карбоксамидиновых производных 5-амино-1,2,3-тиадиазолов.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

ИК спектры зарегистрированы на фурье-спектрометре Bruker Alpha с приставкой НПВО (ZnSe) для образцов соединений в виде порошков. Спектры ЯМР ^1H и ^{13}C зарегистрированы на приборе Bruker DRX-400 (400 и 100 МГц соответственно) в растворе ДМСО- d_6 - CCl_4 , 1:1, внутренний стандарт TMS. Масс-спектры с ионизацией ЭУ записаны на приборе Varian MATT 311A, ускоряющее напряжение 3 кВ, энергия ионизации 70 эВ. Масс-спектр соединения **9a** с ионизацией электрораспылением записан на приборе Bruker Daltonics. Элементный анализ выполнен на CHNS-анализаторе Perkin Elmer 2400 II. Температуры плавления определены на приборе Stuart SMP-10 и не исправлены. Контроль протекания реакций и индивидуальности полученных соединений выполнен с помощью тонкослойной хроматографии на

пластинах Sorbfil UV-254 в системах растворителей хлороформ–гексан, 9:1, и хлороформ–бензол, 7:1.

Тиоамиды **1**, **5a–d** синтезированы по методикам [7, 25], тозилазид **7** – по методике [25]. Азиды **2a–d** получены по методике [21] и соответствуют характеристикам, приведённым в [26, 27].

Этил-5-амино-1-(4-нитрофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-карбоксилат (4a). Суспендируют 0.300 г (2.0 ммоль) тиоамида **1** в растворе этилата натрия, приготовленном из 0.046 г (2.0 ммоль) натрия и 10 мл абсолютного этанола, и добавляют 0.320 г (2.0 ммоль) азиды **2a**. Реакционную смесь перемешивают в течение 1 ч при комнатной температуре, охлаждают до 10 °С, отфильтровывают выпавший осадок и кристаллизуют из этанола. Выход 0.371 г (67%). Бесцветные кристаллы. Т. пл. 174–176 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3447, 3276 (NH), 1733 (C=O). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 1.40 (3H, т, $J = 8.0$, CH_3); 4.36 (2H, к, $J = 8.0$, CH_2); 6.79 (2H, с, NH_2); 7.90 (2H, д, $J = 8.6$, H Ar); 8.43 (2H, д, $J = 8.6$, H Ar). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 277 [M] $^+$ (75), 231 (42), 130 (100), 102 (43), 76 (61). Найдено, %: C 47.57; H 4.12; N 25.39. $\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{N}_5\text{O}_4$. Вычислено, %: C 47.66; H 4.00; N 25.26.

Этил-5-амино-1-(4-хлорфенил)-1H-1,2,3-триазол-4-карбоксилат (4b). Получают аналогично. Выход 60%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 158–160 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3438, 3277 (NH), 1732 (C=O). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 1.39 (3H, т, $J = 8.0$, CH_3); 4.34 (2H, к, $J = 8.0$, CH_2); 6.76 (2H, с, NH_2); 7.9 (2H, д, $J = 8.2$, H Ar); 8.42 (2H, д, $J = 8.2$, H Ar). Найдено, %: C 49.74; H 4.02; N 20.92. $\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{N}_4\text{O}_2\text{Cl}$. Вычислено, %: C 49.54; H 4.16; N 21.01.

Получение 5-амино-1,2,3-триазолов 6a–f (общая методика). К 1.0 ммоль тиоамида **5a–c** в этаноле добавляют эквимолярные количества азиды **2a–d** и триэтиламина. Реакционную смесь перемешивают в течение 1 ч при комнатной температуре, охлаждают до 10 °С, отфильтровывают выпавший осадок и кристаллизуют из этанола.

[5-Амино-1-(4-нитрофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил](морфолин-1-ил)метантион (6a). Выход 80%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 164–167 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3432, 3292 (NH), 3041 (Ar); 2987, 2857 (CH_2). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 3.75–3.85 (4H, м, 2CH_2); 4.20–4.6 (4H, м, 2CH_2); 7.30 (2H, с, NH_2); 7.92 (2H, д, $J = 6.2$, H Ar); 8.45 (2H, д, $J = 6.2$, H Ar). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м. д.: 49.9 (CH_2), 54.0 (CH_2), 66.6 (CH_2); 66.7 (CH_2); 125.6 (=CH); 125.7 (=CH); 126.6 (C-5); 140.3 (=C); 147.1 (C-4); 147.5 (=C); 184.6 (C=S). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 334 [M] $^+$ (33), 103 (11), 86 (100), 76 (24). Найдено, %: C 46.98; H 4.12; N 25.47; S 11.61. $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_6\text{O}_3\text{S}$. Вычислено, %: C 46.70; H 4.22; N 25.13; S 11.89.

[5-Амино-1-(4-хлорфенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил](морфолин-1-ил)метантион (6b). Выход 71%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 168–171 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3367, 3226 (NH), 3040 (Ar), 2928, 2862 (CH_2). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 3.65–3.85 (4H, м, 2CH_2); 4.25–4.55 (4H, м, 2CH_2); 7.07 (2H, с, NH_2); 7.60 (4H, с, H Ar). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 323 [M] $^+$ (27), 210 (100), 153 (67), 111 (34), 76 (14). Найдено, %: C 48.38; H 4.15; N 21.54; S 9.87. $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_5\text{OSCl}$. Вычислено, %: C 48.22; H 4.36; N 21.63; S 9.90.

[5-Амино-1-(4-фторфенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил](морфолин-1-ил)метантион (6c). Выход 53%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 136–138 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3340, 3246 (NH), 3046 (Ar); 2916, 2849 (CH_2). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 3.65–3.85 (4H, м, 2CH_2); 4.20–4.55 (4H, м, 2CH_2); 7.04 (2H, с, NH_2); 7.35–7.42 (2H, м, H Ar); 7.60–7.83 (2H, м, H Ar). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 307 [M] $^+$ (33), 194 (100), 137 (77), 95 (99), 86 (50), 75 (36). Найдено, %: C 50.64; H 4.38; N 22.59; S 10.26. $\text{C}_{13}\text{H}_{14}\text{N}_5\text{FOS}$. Вычислено, %: C 50.80; H 4.54; N 22.79; S 10.43.

[5-Амино-1-(4-метоксифенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил](морфолин-1-ил)метантион (6d). Выход 67%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 155–158 °С. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3347, 3235 (NH), 3010 (Ar); 2916, 2856 (CH_2). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 3.65–3.82 (4H, м, 2CH_2); 3.89 (3H, s, OCH_3); 4.20–4.65 (4H, м, 2CH_2); 6.92 (2H, с, NH_2); 7.15 (2H, д, $J = 6.7$, H Ar); 7.45 (2H, д, $J = 6.7$, H Ar). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 319 [M] $^+$

(16), 206 (100), 191 (48), 149 (68), 108 (20), 77 (52). Найдено, %: С 52.39; Н 5.22; N 21.72; S 10.26. C₁₄H₁₇N₅O₂S. Вычислено, %: С 52.65; Н 5.36; N 21.93; S 10.04.

[5-Амино-1-(4-нитрофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил](пиперидин-1-ил)метан-тион (6e). Выход 44%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 167–170 °С. ИК спектр, ν , см⁻¹: 3434, 3293 (NH), 3085 (Ar); 2903, 2857 (CH₂). Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д. (*J*, Гц): 1.70–1.90 (6H, м, CH₂); 4.13 (4H, с, CH₂); 7.18 (2H, с, NH₂); 7.95 (2H, д, *J* = 8.9, H Ar); 8.45 (2H, д, *J* = 8.9, H Ar). Спектр ЯМР ¹³C, δ , м. д.: 27.4; 50.7; 54.1 (CH₂); 125.6 (=CH); 127.0 (C-5); 140.4 (=C); 147.0 (C-4); 147.5 (=C); 183.6 (C=S). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 332 [M]⁺ (19), 111 (15), 84 (100). Найдено, %: С 50.95; Н 4.32; N 25.59; S 10.01. C₁₄H₁₆N₆O₂S. Вычислено, %: С 50.54; Н 4.85; N 25.28; S 9.65.

[5-Амино-1-(4-нитрофенил)-1H-1,2,3-триазол-4-ил][4-(4-метоксифенил)-пиперазин-1-ил]метантион (6f). Выход 58%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 201–203 °С. ИК спектр, ν , см⁻¹: 3396, 3249 (NH), 3081 (Ar), 2905, 2829 (CH₂). Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д. (*J*, Гц): 3.02–3.38 (4H, м, 2CH₂); 3.74 (3H, с, OCH₃); 4.25–4.65 (4H, м, 2CH₂); 7.25 (2H, с, NH₂); 6.75–6.90 (4H, м, H Ar); 7.95 (2H, д, *J* = 7.9, H Ar); 8.49 (2H, д, *J* = 7.9, H Ar). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 439 [M]⁺ (16), 190 (19), 175 (21), 162 (100), 134 (73), 108 (17), 77 (20). Найдено, %: С 54.49; Н 4.57; N 22.09; S 7.23. C₂₀H₂₁N₇O₃S. Вычислено, %: С 54.66; Н 4.82; N 22.34; S 7.50.

5-(Морфолин-4-ил)-N-гозил-1,2,3-тиадиазол-4-карбоксамидин (9a). Суспендируют 0.31 г (2.0 ммоль) тиамида **5a** в растворе этилата натрия, приготовленном из 0.046 г (2.0 ммоль) натрия и 10 мл абсолютного этанола, и при температуре 10 °С и перемешивании добавляют 0.39 г (2.0 ммоль) толуолсульфанилазида **8**. Выпавший через 30 мин осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из этанола. Выход 80%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 123–125 °С. ИК спектр, ν , см⁻¹: 3400, 3291 (NH), 2960 (CH); 2859 (CH₂); 1143 (S=O). Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д. (*J*, Гц): 2.38 (3H, с, CH₃); 3.20–3.25 (4H, м, CH₂); 3.50–3.53 (4H, м, CH₂); 7.39 (2H, д, *J* = 8.2, H Ar); 7.79 (2H, д, *J* = 8.2, H Ar); 8.39 (1H, s, NH); 9.16 (1H, s, NH). Спектр ЯМР ¹³C, δ , м. д.: 20.9 (CH₃); 53.0 (CH₂); 64.0 (CH₂); 126.2 (=CH); 129.5 (=CH); 136.3 (C=NH); 139.1 (C–SO₂); 142.8 (C–Me); 156.6 (C-4); 170.2 (C-5). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 368 [M+H]⁺. Найдено, %: С 45.59; Н 4.78; N 18.88; S 17.45. C₁₄H₁₇N₅O₃S₂. Вычислено, %: С 45.77; Н 4.63; N 19.07; S 17.43.

5-(Пирролидин-1-ил)-N-гозил-1,2,3-тиадиазол-4-карбоксамидин (9b). Получают аналогично. Выход 82%. Бесцветные кристаллы. Т. пл. 163–165 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ , м. д. (*J*, Гц): 1.87 (4H, с, 2CH₂); 2.38 (3H, с, CH₃); 3.21 (4H, с, 2CH₂); 7.38 (4H, д, *J* = 8.2, H Ar); 7.80 (4H, д, *J* = 8.2, H Ar); 8.26 (1H, с, NH); 9.08 (1H, с, NH). Спектр ЯМР ¹³C, δ , м. д.: 21.3 (CH₃); 26.0 (CH₂); 55.8 (CH₂); 126.8 (=CH); 129.8 (=CH); 134.7 (C=NH); 139.9 (CSO₂); 142.7 (CMe); 157.2 (C-4); 165.3 (C-5). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 351 [M]⁺ (12), 196 (40), 91 (64), 72 (28), 70 (100). Найдено, %: С 47.69; Н 4.72; N 19.81; S 18.45. C₁₄H₁₇N₅O₂S₂. Вычислено, %: С 47.85; Н 4.88; N 19.93; S 18.25.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант 14-03-01033), Фонда Китая (Foundation of China, 21372132) и Китайской программы международного научно-технического сотрудничества (International Science & Technology Cooperation Program of China, 2014DFR41030).

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. S. Mignani, Y. Zhou, T. Lecourt, L. Micouin, L. Micouin, in *Topics in Heterocyclic Chemistry*, J. Košmrj (Ed.), Springer-Verlag, Berlin, Heidelberg, 2012, vol. 28, p. 185.
2. В. П. Кривопапов, О. П. Шкурко, *Успехи химии*, **74**, 369 (2005). [*Russ. Chem. Rev.*, **74**, 339 (2005).]

3. П. Е. Прохорова, Т. А. Калинина, Т. В. Глухарева, Ю. Ю. Моржерин, *Журн. орган. химии*, **48**, 1338 (2012). [*Russ. J. Org. Chem.*, **48**, 1333 (2012).]
4. Т. В. Глухарева, Л. В. Дюдя, Т. А. Поспелова, В. А. Бакулев, А. В. Ткачев, Ю. Ю. Моржерин, *ХГС*, 631 (2005). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **41**, 542 (2005).]
5. Ю. Ю. Моржерин, Т. В. Глухарева, В. А. Бакулев, *ХГС*, 803 (2003). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **39**, 679 (2003).]
6. G. L'abbe, *Bull. Soc. Chem. Belg.*, **99**, 281 (1990).
7. V. A. Bakulev, A. T. Lebedev, E. F. Dankova, V. S. Mokrushin, V. S. Petrosyan, *Tetrahedron*, **45**, 7329 (1989).
8. Ю. М. Шафран, В. А. Бакулев, В. С. Мокрушин, С. Г. Алексеев, *ХГС*, 1266 (1984). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **20**, 1038 (1984).]
9. Е. А. Шафран, В. А. Бакулев, Ю. А. Розин, Ю. М. Шафран, 1295 (2008). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **44**, 1040 (2008).]
10. A. Brik, J. Muldoon, Y.-C. Lin, D. S. Goodsell, A. G. Olson, V. V. Fokin, K. B. Sharpless, C.-H. Wong, *ChemBioChem*, **4**, 1246 (2003).
11. J. Shen, R. Woodward, J. P. Kedenburg, X. Liu, M. Chen, L. Fang, D. Sun, P. G. Wang, *J. Med. Chem.*, **51**, 7417 (2008).
12. A. J. McCarroll, C. S. Matthews, G. Wells, T. D. Bradshaw, M. F. Stevens, *Org. Biomol. Chem.*, **8**, 2078 (2010).
13. W.-T. Li, W.-H. Wu, Ch.-H. Tang, R. Tai, Sh.-T. Chen, *ACS Comb. Sci.*, **13**, 72 (2011).
14. N. Pokhodylo, O. Shyyka, V. Matiychuk, *Sci. Pharm.*, **81**, 663 (2013).
15. C. Pannecouque, B. Szafarowicz, N. Volkova, V. Bakulev, W. Dehaen, Y. Mély, D. Daelemans, *Antimicrob. Agents Chemother.*, **54**, 1461 (2010).
16. V. A. Bakulev, W. Dehaen. *The Chemistry of 1,2,3-Thiadiazoles*, John Wiley & Sons, Inc., Hoboken, 2004.
17. Y. A. Rozin, J. Leban, W. Dehaen, V. G. Nenajdenko, V. M. Muzalevskiy, O. S. Eltsov, V. A. Bakulev, *Tetrahedron*, **68**, 614 (2012).
18. N. T. Pokhodylo, V. S. Matiychuk, M. D. Obushak, *Synth. Commun.*, **40**, 1932 (2010).
19. N. T. Pokhodylo, V. S. Matiychuk, M. D. Obushak, *Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elem.*, **185**, 578 (2010).
20. F. Stazi, D. Cancogni, L. Turco, P. Westerduin, S. Bacchi, *Tetrahedron Lett.*, **51**, 5385 (2010).
21. Н. Т. Походило, В. С. Матийчук, М. Д. Обушак, *ХГС*, 612 (2009). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **45**, 83 (2009).]
22. V. S. Berseneva, Yu. Yu. Morzherin, W. Dehaen, I. Luyten, V. A. Bakulev, *Tetrahedron*, **57**, 2179 (2001).
23. D. R. Buckle, *J. Chem. Res.*, 3670 (1980).
24. Е. Ф. Данкова, В. А. Бакулев, Д. П. Крутько, *ХГС*, 775 (1991). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **27**, 607 (1991).]
25. Е. Ф. Данкова, В. А. Бакулев, М. Ю. Колобов, В. И. Шишкина, Я. Б. Ясман, А. Т. Лебедев, *ХГС*, 1269 (1988). [*Chem. Heterocycl. Compd.*, **24**, 1051 (1988).]
26. М. Д. Обушак, Н. Т. Походило, Н. И. Подлипный, В. С. Матийчук, *Журн. орган. химии*, **44**, 1544 (2008). [*Russ. J. Org. Chem.*, **44**, 1522 (2008).]
27. S. S. Bag, R. Kundu, *J. Org. Chem.*, **76**, 3348 (2011).

¹ Уральский федеральный университет
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
ул. Мира, 19, Екатеринбург 620002, Россия
e-mail: v.a.bakulev@urfu.ru

Поступило 29.04.2014
После доработки 25.05.2014

² Государственная лаборатория элементоорганической химии,
Нанкайский университет,
ул. Вейджин, 94, Тяньцзинь 300071, Китай
e-mail: fanzj@nankai.edu.cn