

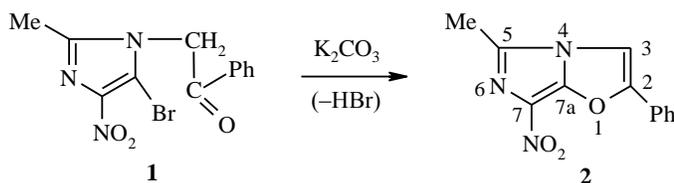
СИНТЕЗ ПЕРВОГО ПРЕДСТАВИТЕЛЯ ГЕТЕРОАРОМАТИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ ИМИДАЗО[5,1-*b*]ОКСАЗОЛА

Ключевые слова: имидазо[5,1-*b*]оксазол, гетероароматическая система, синтез.

Гетероароматическая система имидазо[5,1-*b*]оксазол и ее производные не описаны. Известны лишь производные 2,3,5,7а-тетрагидро- и 2,3,7,7а-тетрагидроимидазо[5,1-*b*]оксазолов, полученные в результате многостадийных синтезов [1, 2].

С целью поиска новых биологически активных веществ нами изучена реакция 1-ацилметил-5-бром-4-нитроимидазолов с основаниями, которая легко протекает с отщеплением молекулы HBr и замыканием оксазольного кольца. В результате был найден простой синтез неизвестных ранее производных имидазо[5,1-*b*]оксазола.

Так, при нагревании 5-бром-2-метил-4-нитро-1-фенилимидазола (**1**) [3] с безводным поташом в безводном ДМФА был получен 5-метил-7-нитро-2-фенилимидазо[5,1-*b*]оксазол (**2**).



Индивидуальность, состав и строение соединения **2** подтверждены данными ТСХ (Silufol UV-254), элементного анализа, масс-спектров и спектров ЯМР ¹H. Спектр ЯМР ¹H получен на приборе Varian Unity-400 (400 МГц) в ДМСО-*d*₆, масс-спектр – на приборе Finnigan SQ-710-MAT (ЭУ, ионизирующее напряжение 70 эВ, прямой ввод).

5-Метил-7-нитро-2-фенилимидазо[5,1-*b*]оксазол (2). Смесь 0.324 г (1 ммоль) имидазола **1** и 0.138 г (1 ммоль) безводного K₂CO₃ в 10 мл безводного ДМФА кипятят 5 ч. После охлаждения к смеси прибавляют 20 мл метанола, нагревают до кипения, прибавляют 0.01 г активированного угля, снова доводят до кипения, фильтруют. Фильтрат упаривают досуха, остаток перекристаллизовывают из минимального количества этанола. Выход соединения **2** 1.51 г (62.1%). Желтые кристаллы с т. пл. 236–237 °С (разл.). *R_f* 0.68 (бутанол–уксусная кислота–вода, 5 : 1 : 4). Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д.: 8.83 (1H, с, СН); 7.79–7.49 (5H, м, H_{аром.}); 3.35 (3H, с, СН₃). Масс-спектр, *m/z*: 243 [M]⁺. Найдено, %: С 59.11; Н 3.72; N 17.27. C₁₂H₉N₃O₃. Вычислено, %: С 59.26; Н 3.73; N 17.28.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. A. R. Katritzky, S. B. Boria, J. Marquet, *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1*, 2065 (1983).
2. Zeng Kun Liaso, H. Kohn, *J. Org. Chem.*, **49**, 3812 (1984).
3. М. В. Повстанной, М. А. Клыков, Н. М. Горбань, П. М. Кочергин, *ХТС*, 855 (1975). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **11**, 751 (1975)].

Е. В. Александрова, П. М. Кочергин^а

Запорожский государственный медицинский
университет, Запорожье 69035, Украина

Поступило 27.11.2006
После доработки 14.03.2007

^аЦентр по химии лекарственных средств –

Всероссийский научно-исследовательский
химико-фармацевтический институт,
Москва 119815, Россия

ХГС. – 2007. – № 5.– С. 792