

2-(1-БУТА-1,3-ДИЕН)-4-[ФЕНИЛ(2-ФУРИЛ)]ЗАМЕЩЕННЫЕ ТИАЗОЛЫ НА ОСНОВЕ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 2,4-ПЕНТАДИЕНТИОАМИДА

В.Д.Дяченко

Луганский национальный университет им. Тараса Шевченко
91011, г. Луганск, ул. Оборонная, 2. E-mail: chem@luguniv.edu.ua

Ключевые слова: конденсация Кнёвенагеля; (E)-3-фенил(2-фурил)акриальдегиды; циантиоацетамид; (2E, 4E)-4-[фенил(2-фурил)]-2-циано-2,4-пентадиентиоамиды; 2-(1-бута-1,3-диен)-4-[фенил(2-фурил)]тиазолы; реакция Ганча

Конденсацией (E)-3-фенил(2-фурил)акриальдегидов с циантиоацетамидом получены (2E, 4E)-4-фенил(2-фурил)-2-циано-2,4-пентадиентиоамиды, на основе которых синтезированы замещенные 4-арил(гетерил)-2-(1-бута-1,3-диен)тиазолы.

2-(1-BUTA-1,3-DIEN)-4-[PHENYL(2-FURYL)] SUBSTITUTED THIAZOLES ON THE BASIS OF NEW 2,4-PENTADIENETHIOAMIDE DERIVATIVES

V.D.Dyachenko

(2E, 4E)-2-Cyano-4-phenyl(2-furyl)-2,4-pentadienethioamides have been obtained by condensation of (E)-3-phenyl(2-furyl)acrylaldehyde with cyanthioacetamide and used in the synthesis of 4-[aryl(2-furyl)]-2-(buta-1,3-dien)thiazoles derivatives.

2-(1-БУТА-1,3-ДИЕН)-4-[ФЕНИЛ(2-ФУРИЛ)]ЗАМІЩЕНІ ТІАЗОЛИ НА ОСНОВІ НОВИХ ПОХІДНИХ 2,4-ПЕНТАДІЄНТІОАМІДУ

В.Д.Дяченко

Конденсацією (E)-3-феніл(2-фурил)акриальдегідів із ціанотіоацетамідом отримані (2E, 4E)-4-феніл(2-фурил)-2-ціано-2,4-пентадієнтіоаміди, на основі яких синтезовані заміщені 4-арил(гетерил)-2-(1-бута-1,3-дієн)тіазоли.

Замещенные тиазолы нашли применение в качестве ингибиторов протеазы ВИЧ [1], препаратов для лечения болезни Альцгеймера [2], воспалительных процессов [3, 4] и опухолей [5, 6].

С целью поиска новых биологически активных соединений указанного типа в настоящей работе изучена реакция замещенных акролеинов **1a-c** с циантиоацетамидом **2** в этаноле при 20°C в присутствии морфолина. Обнаружено, что она протекает по типу конденсации Кневенагеля с образованием соответствующих замещенных 1,3-бутадиенов **3a-c**. Отметим, что кротоновый альдегид, в отличие от акролеинов **1 a-c**, взаимодействует с циантиоацетамидом **2** в основной среде по Михаэлю с образованием 4-метил-3-цианопиридин-2(1H)-тиона [7].

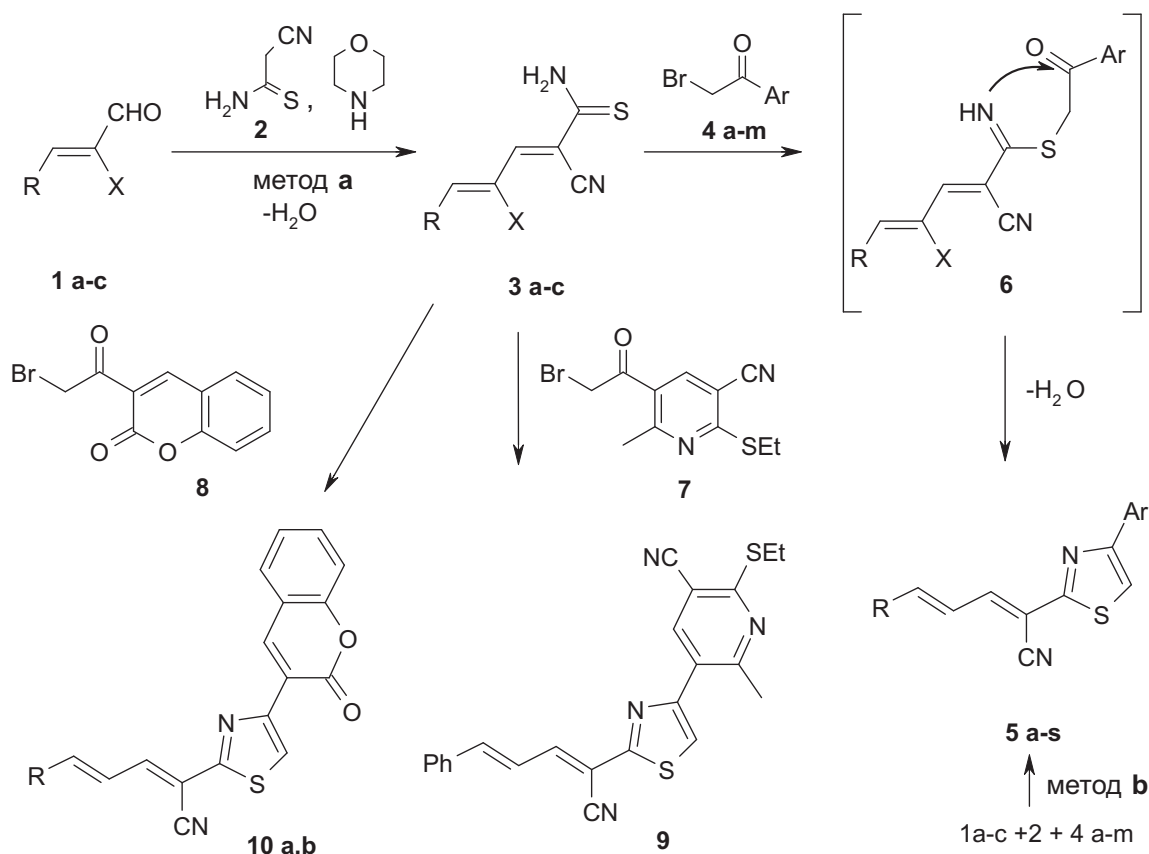
Взаимодействие тиамидов **3a-c** с α-бромкарбонильными соединениями **4a-m** в ДМФА при 20°C очевидно протекает через образование интермедиатов **6** и приводит к замещенным тиазолам Ганча **5a-s** (метод **a**). Последние также легко получают в аналогичных условиях трехкомпонентной конденсацией альдегидов **1a-c**, циантиоацетамида **2** и α-бромкетонов **4a-m** (метод **b**). Использование в этой конденсации в качестве реагентов 3-бромацетилпиридина **7** и 3-бром-

ацетилкумарина **8** позволяет получить соответствующие производные **9** и **10a,b**. При этом следует особо отметить полифункциональный тиазолзамещенный пиридин **9**, аналоги которого оказались перспективными при создании люминофоров [8-11], препаратов с противомикробным [12] и антиаллергическим действием [13], а также в синтезе природных антибиотиков [14-19].

Спектральные и физико-химические характеристики подтверждают строение соединений **3a-c**, **5a-c**, **9** и **10a,b**, при определении структурных параметров которых учитывались данные работ [20, 21] (схема).

Экспериментальная часть

Температуры плавления определены на блоке Кофлера. Спектры ЯМР ¹H получены на спектрометре Varian Mercury-400 (400.397 МГц) в ДМСO-d₆, внутренний стандарт – ТМС. ИК-спектры сняты на спектрофотометре ИКС-40 в вазелиновом масле. Масс-спектры зарегистрированы на приборах Kratos MS-890 (ЭУ, 70 эВ) с применением прямого ввода вещества в ионный источник и Crommas GS/MS – Hewlett-Packard 5890/5972, колонка HP-5MS (ХИ, 70 эВ). Контроль за ходом ре-



1, 3 a R=Ph, X=H; **b** R=Ph, X=Br; **c** R=2-фурил, X=H; **4 a** Ar=2-HOC₆H₄, **b** Ar=4-циклогексил-фенил, **c** Ar=4-FC₆H₄, **e** Ar=4-BuC₆H₄, **f** Ar=4-MeOC₆H₄, **g** Ar=2,3,5-Me₃C₆H₂, **h** Ar=4-ClC₆H₄, **i** Ar=4-NO₂C₆H₄, **j** Ar=4-MeC₆H₄, **k** Ar=4-EtOC₆H₄, **l** Ar=Ph, **m** Ar=4-BrC₆H₄; **5 a** R=Ph, X=H, Ar=2-HOC₆H₄, **b** R=Ph, X=H, Ar=4-циклогексилфенил; **c** R=Ph, X=H, Ar=4-FC₆H₄; **d** R=Ph, X=H, Ar=4-PhC₆H₄; **e** R=Ph, X=H, Ar=4-BuC₆H₄; **f** R=Ph, X=H, Ar=4-MeOC₆H₄; **g** R=Ph, X=H, Ar=4-ClC₆H₄; **h** R=Ph, X=Br, Ar=4-ClC₆H₄; **i** R=Ph, X=Br, Ar=4-NO₂C₆H₄; **j** R=Ph, X=Br, Ar=4-MeC₆H₄; **k** R=Ph, X=Br, Ar=4-MeOC₆H₄; **l** R=Ph, X=Br, Ar=4-EtOC₆H₄; **m** R=Ar=Ph, X=Br; **n** R=Ph, X=Br, Ar=4-BrC₆H₄; **o** R=2-фурил, X=H, Ar=2,3,5-Me₃C₆H₂; **p** R=2-фурил, X=H, Ar=4-BrC₆H₄; **q** R=2-фурил, X=H, Ar=4-BrC₆H₄; **r** R=2-фурил, X=H, Ar=4-MeOC₆H₄; **10 a** R=Ph, **b** R=2-фурил.

Схема

акции и индивидуальностью полученных соединений осуществляли методом ТСХ на пластине Silufol UV-254 в системе ацетон-гексан 3:5, проявители – пары йода и УФ-облучение.

Синтез 5-замещенных (2E, 4E)-2-цианопента-2,4-диентиоамидов 3a-c. К перемешиваемому раствору 10 ммоль альдегида **1a-c** в 20 мл этанола при 20°C прибавляют 1.0 г (10 ммоль) циантоацетамида **2** и каплю морфолина, перемешивают 2 ч и оставляют на сутки. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают этанолом, гексаном и кристаллизуют из этанола.

(2E, 4E)-5-Фенил-2-цианопента-2,4-диентиоамид 3a. Выход – 63%, красные кристаллы, Т.пл. – 160-161°C (AcOH) (лит.: [22] – 149°C).

(2E, 4E)-4-Бром-5-фенил-2-цианопента-2,4-диентиоамид 3b. Выход – 70%, рубиновые кристаллы, Т.пл. – 138-140°C. ИК-спектр, ν , см⁻¹: 3335, 3294, 3158 (NH₂), 2215 (CN). Спектр ЯМР ¹H (δ, м.д., J, Гц): 5.21 (с, 1H, CH=), 6.65 (с, 1H, CH=CBr), 7.31-7.41 (м, 7H, Ph и NH₂). Масс-спектр (ЭУ, m/z, I_{омн.}, %): 294 (4) [M+1]⁺, 293 (3) [M]⁺, 213 (100) [M-Br]⁺, 180 (16), 152 (8), 127 (7), 106 (S), 77 (9)

[Ph]⁺, 51 (5). Найдено, %: C 49.04; H 2.97; N 9.41. C₁₇H₉BrN₂S. Вычислено, %: C 49.16; H 3.09; N 9.56.

(2E, 4E)-5-(2-Фурил)-2-цианопента-2,4-диентиоамид 1c. Выход – 92%, оранжевый порошок, Т.пл. – 175-176°C. ИК-спектр, ν , см⁻¹: 3340, 3298, 3158 (NH₂), 2212 (CN). Спектр ЯМР ¹H (δ, м.д., J, Гц): 6.68 (1H, д, H⁵ фурана, J = 2.4), 7.29 (1H, д, CH=, J = 12.0), 7.92 (2H, ш.с., CH= и H³ фурана), 9.36 (1H, ш.с., NH₂), 9.87 (1H, ш.с., NH₂). Масс-спектры (ХИ, m/z, I_{омн.}, %): 203 (100) [M-1]⁺. Найдено, %: C 58.75; H 3.79; N 13.66. C₁₀H₈N₂OS. Вычислено, %: C 58.81; H 3.95; N 13.42.

(2E, 4E)-2-(1-Бута-1,3-диен-4-[фенил(2-фурил)]-1-цианотиазолы 5a-s, 9, 10a,b. Метод а. Смесь 10 ммоль тиамида **3a-c** и 10 ммоль α-бромкетона **4a-m** в 15 мл ДМФА при 20°C перемешивают 4 ч и через 24 ч реакционную смесь разбавляют равным объемом воды и отфильтровывают образовавшийся осадок. Промывают водой, этанолом и гексаном. Перекристаллизуют из подходящего растворителя (табл. 1, 2).

Масс-спектр соединения 5a (ЭУ, m/z, I_{омн.}, %): 332 (7) [M+2]⁺, 330 (38) [M]⁺, 253 (100) [M-Ph]⁺, 121 (22), 89 (9) [C₄H₅]⁺, 77 (11) [Ph]⁺.

Таблиця 1

Характеристики синтезованих сполучень (5a-s, 9, 10a,b)

Соединение	Выход, % метод а/б	Т.пл., °С (растворитель для кристаллизации)	Найдено, %			Формула	Вычислено, %		
			С	Н	N		С	Н	N
5a	81/83	171-173 (AcOH)	75.61	4.12	8.33	C ₂₀ H ₁₄ N ₂ OS	72.70	4.27	8.48
5b	88/75	178-179 (BuOH)	78.68	6.02	6.89	C ₂₆ H ₂₄ N ₂ S	78.75	6.10	7.06
5c	77/70	161-163 (AcOH)	72.14	3.88	8.37	C ₂₀ H ₁₃ FN ₂ S	72.27	3.94	8.43
5d	81/85	198-200 (DMF)	79.85	4.52	7.08	C ₂₆ H ₁₈ N ₂ S	79.97	4.65	7.17
5e	69/68	121-123 (MeOH)	77.69	5.78	7.42	C ₂₄ H ₂₂ N ₂ S	77.80	5.99	7.56
5f	73/72	184-186 (BuOH)	73.15	4.51	8.04	C ₂₁ H ₁₆ N ₂ OS	73.23	4.68	8.13
5g	70/66	109-111 (MeOH)	68.77	3.60	7.96	C ₂₀ H ₁₃ ClN ₂ S	68.86	3.76	8.03
5h	85/86	137-138 (EtOH)	56.10	2.77	6.48	C ₂₀ H ₁₂ BrClN ₂ S	51.16	2.83	6.55
5i	78/81	167-168 (AcOH)	54.72	2.69	9.43	C ₂₀ H ₁₂ BrN ₂ O ₂ S	54.81	2.76	9.59
5j	79/80	181-182 (DMF)	61.80	3.65	6.72	C ₂₁ H ₁₅ BrN ₂ S	61.92	3.71	6.88
5k	85/79	121-122* (EtOH)	59.42	3.40	6.58	C ₂₁ H ₁₅ BrON ₂ S	59.58	3.57	6.62
5l	80/84	131-133* (AcOH)	60.35	3.88	6.33	C ₂₂ H ₁₇ BrON ₂ S	60.42	3.92	6.41
5m	78/71	107-108 (AcOH)	60.95	3.22	7.04	C ₂₀ H ₁₃ BrN ₂ S	61.08	3.33	7.12
5n	80/75	143-144* (BuOH)	50.71	2.44	5.81	C ₂₀ H ₁₂ Br ₂ N ₂ S	50.87	2.56	5.93
5o	71/80	108-110 (MeOH)	72.71	5.08	7.93	C ₂₁ H ₁₈ N ₂ OS	72.81	5.24	8.09
5p	82/78	174-175 (AcOH)	56.29	2.70	7.15	C ₁₈ H ₁₁ BrN ₂ OS	56.41	2.89	7.31
5q	79/82	150-151 (AcOH)	63.70	3.19	8.08	C ₁₈ H ₁₁ ClN ₂ OS	63.81	3.27	8.27
5r	77/83	256-258 (BuOH)	61.72	3.04	11.95	C ₁₈ H ₁₁ N ₂ O ₃ S	61.88	3.17	12.03
5s	78/77	126-127 (BuOH)	68.14	4.09	8.21	C ₁₉ H ₁₄ N ₂ O ₂ S	68.25	4.22	8.38
9	84	165-167 (AcOH)	66.50	4.29	13.45	C ₂₃ H ₁₈ N ₄ S ₂	66.64	4.38	13.52
10a	72	177-179 (BuOH)	72.14	3.55	7.21	C ₂₃ H ₁₄ N ₂ O ₂ S	72.23	3.69	7.33
10b	75	169-171 (BuOH)	67.58	3.19	7.44	C ₂₁ H ₁₂ N ₂ O ₃ S	67.73	3.25	7.52

* При УФ-облучении флуоресцирует

Таблиця 2

Данные ИК- и ЯМР ¹H спектров синтезованных соединений (5a-s, 9, 10a,b)

Соединение	ИК-спектр, ν, см ⁻¹ C≡N	Спектр ЯМР ¹ H (δ, м.д., J, Гц)	
		1	2
1	2	3	
5a	2215 3448 (ОН)	6.89 (1H, т, H _{аром.} , J = 7.8), 6.92 (1H, д, CH=, J = 10.6), 7.10-7.46 (6H, м, H _{аром.} и CH=), 7.62 (2H, м, H _{аром.}), 8.05 (2H, м, H _{аром.} и CH=), 8.18 (1H, с, H ⁵ тиазола), 10.21 (1H, ш.с, ОН)	
5b	2214	1.22-1.48 (6H, м, циклогексан), 1.63-1.99 (5H, м, циклогексан), 7.22-7.43 (7H, м, H _{аром.} и CH=), 7.54-7.65 (2H, м, H _{аром.} и CH=), 7.87 (2H, д, H _{аром.} , J = 7.6), 7.91 (1H, с, H ⁵ тиазола), 8.06 (1H, д, CH=, J = 10.48)	
5c	2213	7.05-7.47 (7H, м, 6H _{аром.} и CH=), 7.51-7.72 (3H, м, H _{аром.} и CH=), 7.95-8.01 (2H, м, H _{аром.} и CH=), 8.19 (1H, с, H ⁵ тиазола)	
5d	2218	7.11-7.52 (6H, H _{аром.} и CH=), 7.61-7.89 (6H, H _{аром.} и CH=), 8.09 (1H, с, H ⁵ тиазола), 8.11-8.32 (5H, м, H _{аром.} и CH=)	
5e	2216	0.89 (3H, т, Me, J = 7.18), 1.11-1.78 (4H, м, 2CH ₂), 2.60 (2H, т, CH ₂ , J = 7.72), 7.11-7.41 (5H, H _{аром.} и CH=), 7.62-7.79 (2H, м, H _{аром.} и CH=), 7.91 (3H, д, H _{аром.} , J = 7.05), 8.11 (3H, м, H _{аром.} и CH=)	
5f	2214	3.89 (3H, с, Me), 7.11-7.55 (5H, м, H _{аром.} и CH=), 7.61-7.79 (2H, м, H _{аром.} и CH=), 7.85-8.24 (6H, H _{аром.} и CH=)	
5g	2215	7.08-7.79 (9H, м, 6H _{аром.} и 3H бутадиена), 8.01 (2H, д, H _{аром.} , J = 8.58), 8.21 (2H, д, H _{аром.} , J = 8.58)	

1	2	3
5h	2213	7.33-7.48 (5H, м, $H_{аром.}$), 7.83-7.94 (2H, м, $H_{аром.}$), 7.99 (1H, с, CH=), 8.04 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 8.54$), 8.16 (1H, с, CH=), 8.23 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5i	2214	7.42-7.58 (3H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.91 (2H, м, $H_{аром.}$), 8.08 (1H, с, CH=), 8.32 (5H, ш.с, Ph), 8.57 (1H, H ⁵ тиазола)
5j	2217	2.42 (3H, с, Me), 7.22 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 7.84$), 7.53-7.62 (4H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.88 (1H, с, CH=), 7.91 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 7.72$), 8.01 (2H, м, $H_{аром.}$), 8.30 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5k	2212	3.82 (3H, с, Me), 6.95 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 8.64$), 7.15-7.28 (3H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.86-8.01 (6H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 8.19 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5l	2213	1.42 (3H, т, Me, $J = 6.94$), 4.06 (2H, к, CH ₂ , $J = 6.94$), 6.91 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 8.9$), 7.32-7.58 (3H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.69-7.98 (6H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 8.18 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5m	2216	7.23-7.49 (6H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.82-8.08 (6H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 8.22 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5n	2218	7.25-7.44 (3H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.58 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 8.28$), 7.79-7.85 (2H, м, $H_{аром.}$), 7.96 (2H, д, $H_{аром.}$, $J = 8.28$), 8.02 (1H, с, CH=), 8.22 (2H, уш. с., $H_{аром.}$)
5o	2214	2.28 (6H, с, 2Me), 2.39 (3H, с, Me), 6.62 (1H, д,д, H ⁴ фурана, $J = 2.38$), 6.88 (1H, д, H ³ фурана, $J = 2.95$), 7.05 и 7.09 (1H, оба д, CH=, $J = 10.11$), 7.07 (1H, с, $H_{аром.}$), 7.34 (1H, д, CH=, $J = 10.11$), 7.38 (1H, с, $H_{аром.}$), 7.72 (1H, с, H ⁵ тиазола), 7.83 (1H, д, H ⁵ фурана, $J = 1.19$), 8.04 (1H, д, CH=, $J = 10.11$)
5p	2215	6.71 (2H, д,д, H ⁴ фурана, $J = 2.41$), 6.98 (1H, д, H ³ фурана, $J = 2.92$), 7.04 и 7.07 (1H, оба д, CH=, $J = 10.18$), 7.42 (1H, д, CH=, $J = 10.18$), 7.68 и 8.15 (по 2H, оба д, BrC ₆ H ₄ , $J = 7.51$), 7.93 (1H, д, H ⁵ фурана, $J = 1.22$), 8.15 (1H, д, CH=, $J = 10.18$), 8.31 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5q	2214	6.69 (1H, д,д, H ⁴ фурана, $J = 2.44$), 6.98 (1H, д, H ³ фурана, $J = 2.88$), 7.02 и 7.06 (1H, оба д, $J = 10.29$), 7.41 (1H, д, CH=, $J = 10.22$), 7.55 и 8.02 (по 2H, оба д, ClC ₆ H ₄ , $J = 8.58$), 7.93 (1H, д, H ⁵ фурана, $J = 1.18$), 8.15 (1H, д, CH=, $J = 10.22$), 8.28 (1H, с, H ⁵ тиазола)
5r	2212	6.51 (1H, д,д, H ⁴ фурана, $J = 2.35$), 6.62 (1H, д, H ³ фурана, $J = 2.95$), 7.11-7.24 (2H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.68 (1H, д, H ⁵ фурана, $J = 1.99$), 8.06 (1H, д, CH=, $J = 10.14$), 8.22-8.33 (5H, м, H ⁵ тиазола, CH=, $H_{аром.}$)
5s	2216	4.11 (3H, с, Me), 6.66 (1H, д,д, H ⁴ фурана, $J = 2.42$), 7.02 (1H, д, H ³ фурана, $J = 2.92$), 7.19 и 8.16 (по 2H, оба д, C ₆ H ₄ , $J = 8.54$), 7.35-7.46 (2H, м, 2CH=), 7.91 (1H, д, H ⁵ фурана, $J = 1.23$), 8.01 (1H, с, H ⁵ тиазола), 8.27 (1H, д, CH=, $J = 10.14$)
9	2222 2214	1.41 (3H, т, CH ₃ CH ₂ , $J = 7.42$), 2.82 (3H, с, Me), 3.34 (2H, к, CH ₂ , $J = 7.42$), 7.31 (2H, т, Ph, $J = 6.95$), 7.39-7.48 (2H, м, Ph и CH=), 7.55 (1H, д, CH=, $J = 10.34$), 7.68 (2H, д, Ph, $J = 7.03$), 8.09 (1H, с, H ⁴ пиридина), 8.15 (1H, д, CH=, $J = 10.34$), 8.39 (1H, с, H ⁵ тиазола)
10a	2215 1718 (C=O)	7.21-7.49 (6H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.55 (1H, д, CH=, $J = 10.15$), 7.61-7.72 (3H, м, $H_{аром.}$), 7.84 (1H, $H_{аром.}$, $J = 7.04$), 8.15 (1H, д, CH=, $J = 10.15$), 8.49 (1H, с, H ⁵ тиазола), 8.82 (1H, с, H ⁴ кумарина)
10b	2214 1716 (C=O)	6.81 (1H, уш. с, H ⁴ фурана), 7.07 (1H, уш.с, H ³ фурана), 7.38-7.55 (2H, м, $H_{аром.}$ и CH=), 7.57-7.74 (2H, м, $H_{аром.}$), 7.86 (1H, м, $H_{аром.}$), 7.96 (1H, уш.с, H ³ фурана), 8.08 (1H, м, CH=), 8.31 (1H, д, CH=, $J = 10.08$), 8.72 (1H, с, H ⁵ тиазола), 9.11 (1H, с, H ⁴ кумарина)

Масс-спектр соединения 5h (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 429 (3) [M+2]⁺, 428 (12) [M+1]⁺, 427 (11) [M]⁺, 347 (100) [M-Br]⁺, 311 (28) [M-Br-Cl]⁺, 269 (22), 168 (19), 152 (17), 133 (27), 89 (43) [C₇H₅]⁺, 77 (15) [Ph]⁺, 63 (12), 51 (10), 40 (11).

Масс-спектр соединения 5i (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 439 (7) [M+1]⁺, [M]⁺ отсутствует, 437 (9) [M-1]⁺, 358 (100) [M-Br]⁺, 312 (39) [M-Br-NO₂]⁺, 89 (28) [C₇H₅]⁺, 77 (15) [Ph]⁺, 63 (6).

Масс-спектр соединения 5j (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 408 (2) [M+1]⁺, 407 (5) [M]⁺, 406 (6) [M-1]⁺, 327 (180) [M-Br]⁺, 249 (41) [M-Br-C₆H₆]⁺, 164 (22), 147 (33), 115 (29), 91 (14) [PhCH₂]⁺, 89 (13) [C₇H₅]⁺, 77 (16) [Ph]⁺, 51 (8), 39 (5).

Масс-спектр соединения 5k (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 425 (4) [M+2]⁺, 424 (19) [M+1]⁺, 423 (19) [M-1]⁺, 343 (100) [M-Br]⁺, 311 (10), 299 (12), 265 (41)

[M-Br-C₆H₆]⁺, 171 (25), 149 (35), 121 (39), 89 (15) [C₇H₅]⁺, 77 (34) [Ph]⁺, 51 (8).

Масс-спектр соединения 5l (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 439 (3) [M+2]⁺, 438 (22) [M+1]⁺, 437 (25) [M]⁺, 357 (100) [M-Br]⁺, 279 (28), 251 (32), 223 (15), 164 (28), 150 (23), 150 (23), 121 (37), 89 (16) [C₇H₅]⁺, 77 (29) [Ph]⁺, 51 (9), 40 (8).

Масс-спектр соединения 5m (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 394 (2) [M+1]⁺, 393 (10) [M]⁺, 392 (12) [M-1]⁺, 313 (100) [M-Br]⁺, 235 (31), 156 (18), 134 (25), 89 (23) [C₇H₅]⁺, 77 (11) [Ph]⁺.

Масс-спектр соединения 5n (ЭУ, m/z , $I_{отн.}$, %): 474 (2) [M+2]⁺, 471 (15) [M+1]⁺, 472 (23) [M]⁺, 391 (95) [M-1-Br]⁺, 311 (58) [M-1-2Br]⁺, 235 (81) [M-2Br-Ph-1]⁺, 152 (28), 133 (39), 89 (100) [C₇H₅]⁺, 77 (29) [Ph]⁺, 63 (21), 51 (20), 39 (10).

Масс-спектр соединения 5o (ХИ, m/z , $I_{\text{отн.}}$, %): 347 (100) $[M+1]^+$.

Масс-спектр соединения 9 (ЭУ, m/z , $I_{\text{отн.}}$, %): 416 (4) $[M+2]^+$, 415 (7) $[M+1]^+$, 414 (50) $[M]^+$, 337 (100) $[M-Ph]^+$, 303 (14), 115 (22), 91 (29) $[C_6H_7]^+$, 77 (6) $[Ph]^+$, 61 (4) $[EtS]^+$, 45 (8).

Метод b. Смесь 10 ммоль альдегида **1a-c**, 1.0 г (10 ммоль) циантоацетамида **2** и 10 ммоль α -бромкетона **4a-m** в 15 мл ДМФА при 20°C перемешивают 8 ч. Через 24 ч реакционную смесь разбавляют равным объемом воды и отфильтровывают образовавшийся осадок. Получают соединения **5a-s**, идентичные по температуре

плавления и данным хроматографии синтезированным по методу **a**.

Выводы

1. Конденсацией (E)-3-фенил(2-фурил)акрильальдегидов с циантоацетамидом в условиях реакции Кнёвенагеля синтезированы (2E, 4E)-4-фенил(2-фурил)-2-циано-2,4-пентадиентиамида.

2. Полученные тиамида взаимодействуют с α -бромкетонами с образованием замещенных 4-арил(гетерил)-2-(1-бута-1,3-диен)тиазолов – перспективных полупродуктов при создании биологически активных соединений.

Литература

1. Пат. США 5559158 // РЖХим. – 1999. – 110170П.
2. Заявка Франции 2735777 // РЖХим. – 1999. – 100119П.
3. Пат. США 6720347 // РЖХим. – 2005. – 190158П.
4. Пат. США 5668161 // РЖХим. – 1999. – 80114П.
5. Пат. США 6784198 // РЖХим. – 2005. – 190135П.
6. Пат. США 6720427 // РЖХим. – 2005. – 190172П.
7. Шелякин В.В., Дяченко В.Д., Шаранин Ю.А. // ХГС. – 1995. – №2. – С. 269.
8. Сизова З.А., Дорошенко А.О., Карасев А.А. и др. // Тез. доп. II Всеукр. наук. конф. студентів, аспірантів і молодих учених «Хімічні проблеми сьогодення». – 18-20 березня 2008 р. – Донецьк. – С. 86.
9. Juo X., Song J., Cheng J., Huang D. // Sci. in China. Ser. B. – 2001. – Vol. 44, №5. – P. 532-539 / РЖХим. – 2002. – 19Н131.
10. Пат. США 656658 // РЖХим. – 2004. – 19Н251П.
11. Кузів Я.Б., Іщенко В.В., Хиля В.П., Дубей І.Я. // Ukrainika Bioorganica Acta. – 2008. – №1. – P. 3-12.
12. Abdelhamid A.O., Al-Atoom A.A. // Phosph., Sulfur, Silicon and Relat. Elem. – 2005. – Vol. 180, №7. – P. 1629-1646.
13. Пат. США 6451829 // РЖХим. – 2004. – 190200П.
14. Okumura K., Suzuki T., Shin C. // Heterocycles. – 2000. – Vol. 53, №4. – P. 765-770.
15. Shin C., Okumura K., Shigekuni M., Nakamura Y. // Chem. Lett. – 1998. – №2. – P. 139-140.
16. Okumura K., Nakamura Y., Shin C. // Bull. Chem. Soc. Jpn. – 1999. – Vol. 72, №7. – P. 1561-1569.
17. Okumura K., Saito H., Shin C. et al. // Bull. Chem. Soc. Jpn. – 1998. – Vol. 71, №8. – P. 1863-1870.
18. Umemura K., Noda H., Yochimura J. et al. // Tetrahedron Lett. – 1997. – Vol. 38, №20. – P. 3539-3542.
19. Umemura K., Noda H., Yochimura J. et al. // Bull. Chem. Soc. Jpn. – 1998. – Vol. 71, №6. – P. 1391-1396.
20. Nesterov V.N., Antipin M.Yu., Timofeeva T.V., Clarc R.D. // Acta Crystallogr. C. – 2000. – Vol. 71, №1. – P. 88-89.
21. Кривоколыско С.Г., Дяченко В.Д., Нестеров В.Н., Литвинов В.П. // ХГС. – 2001. – №7. – С. 929-934.
22. Ho Y.W., Wang I.J. // J. Heterocyclic Chem. – 1995. – Vol. 32, №3. – P. 819-825.

Надійшла до редакції 16.02.2012 р.