

**Химия и биологическая активность
синтетических и природных соединений**

**КИСЛОРОД- И
СЕРУСОДЕРЖАЩИЕ
ГЕТЕРОЦИКЛЫ**

Под редакцией докт. хим. наук В.Г. Карцева

Том 2

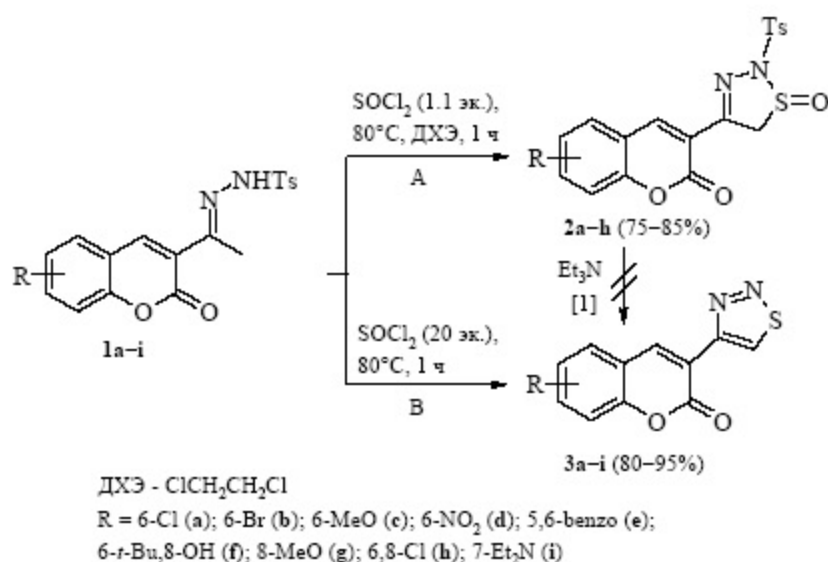
Москва 2003
IBS PRESS

Реакция Харда–Моури в синтезе новых производных кумарина

Борисов А.В., Джавахишвили С.Г., Горобец Н.Ю., Никитченко В.М.

Харьковский Национальный университет им. В.Н. Каразина
61077, Украина, Харьков, пл. Свободы, 4

Реакция Харда–Моури [1], приводящая к производным 1,2,3-тиадиазола, в последние годы активно изучается [2–7]. Анализ литературных данных, однако, выявил некоторые противоречия относительно продуктов и механизма этой реакции. нас привлекла возможность объединения двух интересных с точки зрения биологической активности структурных фрагментов 1,2,3-тиадиазола и кумарина в одной молекуле. нами было изучено взаимодействие тозилгидразонов 3-ацетилкумаринов с хлористым тионилем в различных условиях.



Были найдены оптимальные условия как для получения производных 3-(2,5-дигидро-[1,2,3]-тиадиазол-1-оксид)кумарина 2a–h с примесью соответствующих 3-([1,2,3]-тиадиазолил-4)кумаринов 3a–h менее чем 5% (метод А), так и для производных 3-([1,2,3]-тиадиазолил-4)кумарина 3a–i (метод В). В случае 7-диэтиламинокумарина Ii наблюдалось только превращение в соответствующий 3-([1,2,3]-тиадиазолил-4)кумарин 3i. Интересно отметить, что ожидаемое превращение тиадиазолоксидов 2a–h в тиадиазолы 3a–h не наблюдалось в предложенных авторами [1] условиях.

1. Hurd C.D., Mori R.I., *J. Am. Chem. Soc.* **1955** 77 5359.
2. Hezek D., Rybar A., *Monatsh. Chem.* **1994** 125 (11) 1273.
3. Morzherin Yu.Yu., Tarasov E.V., Bakulev V.A., *Khim. Geterotsikl. Soedin.* **1994** (4) 554.
4. Tsubata, *et al.*, US Patent 6 337 341, 2002.
5. Sammelson R.E., Kurth J.M., *Chem. Rev.* **2001** (101) 139.
6. Keitaro S., Misuzu I., Sadao N., *J. Org. Chem.* **1978** 43 (9) 1677.
7. Katritzky A.R., *J. Org. Chem.* **2001** 66 4045.