

3. W. Kemnitzer, J. Drewe, S. Jiang, H. Zhang, J. Zhao, C. Crogan-Grundy, L. Xu, S. Lamothe, H. Gourdeau, R. Denis, B. Tseng, S. Kasibhatla, S. X. Cai, *J. Med. Chem.*, **50**, 2858 (2007).
4. D. Cox, H. Cairns, N. Chadwick, J. L. Suschitzky, US Pat. Appl. 4419352.
5. R. W. Van De Water, T. R. R. Pettus, *Tetrahedron*, **58**, 5367 (2002).
6. M. von Strandtmann, M. P. Cohen, J. Shavel, Jr., *J. Heterocycl. Chem.*, **7**, 1311 (1970).
7. Y. Chen, M. G. Steinmetz, *J. Org. Chem.*, **71**, 6053 (2006).
8. J. H. Burckhalter, R. I. Leib, *J. Org. Chem.*, **26**, 4078 (1961).
9. C. J. Kowalski, K. W. Fields, *J. Org. Chem.*, **46**, 197 (1981).

В. А. Осянин*, **Д. В. Осипов**, **Ю. Н. Климошкин**

Самарский государственный
технический университет,
ул. Молодогвардейская, 244, Самара 443100, Россия
e-mail: VOsyenin@mail.ru

Поступило 15.09.2011

ХГС. – 2011. – № 12. – С. 1907

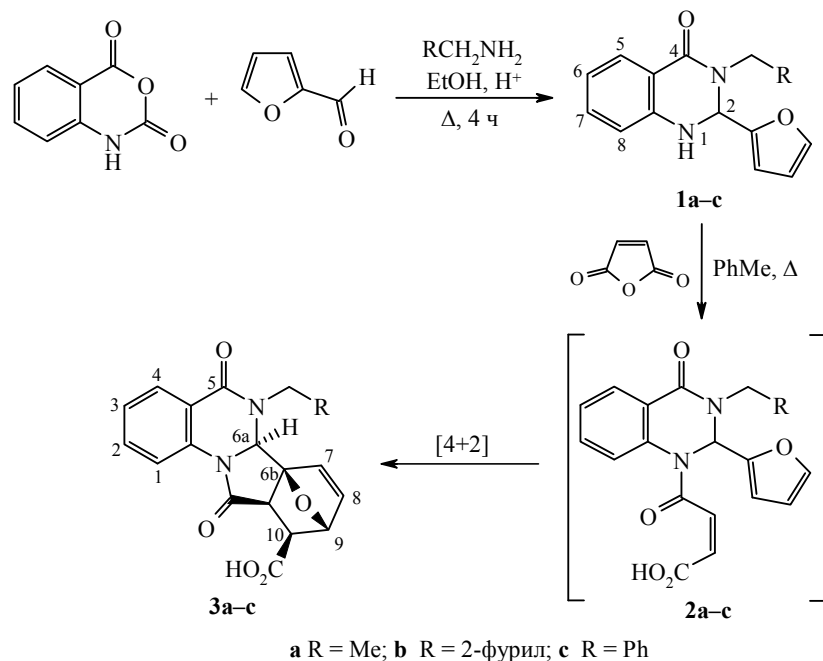
ПЕРВЫЙ ПРЕДСТАВИТЕЛЬ 6b,9-ЭПОКСИИЗОИНДОЛО- [2,1-*a*]ХИНАЗОЛИН-10-КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ

Ключевые слова: изоиндоло[2,1-*a*]хиназолины, 2-фурилхиназолин-4-оны, фурфуриламины, внутримолекулярное [4+2]-циклоприсоединение, реакция Дильса–Альдера.

Нами разработан синтетический подход к получению эпоксиизоиндолонов, конденсированных с различными гетероциклами, базирующийся на циклоприсоединении производных непредельных кислот к α -фурилзамещённым гидрированным азагетероциклам [1]. Для установления синтетических границ изучаемого метода мы синтезировали 2-фурил-3-алкилхиназолины **1** по методу, приведённому в работе [2], и впервые изучили их взаимодействие с малеиновым ангидридом.

Ацилирование хиназолин-4-онов **1a–c** кипячением в толуоле с малеиновым ангидридом сопровождается спонтанным *экзо*-[4+2]-циклоприсоединением *N*-малеинамидного фрагмента к 2-фурильному заместителю [3, 4]. Эпоксиизоиндолохиназолинкарбоновые кислоты **3a–c** образуются в виде единственного диастереомера с выходом от среднего до количественного.

Кипячением в метаноле с каталитическим количеством концентрированной серной кислоты соединение **3b** было превращено в метиловый эфир (6*aR**,6*bS**,9*R**,10*S**,10*aR**)-5,11-диоксо-6-(2-фурилметил)-6,6*a*,9,10,10*a*,11-гексагидро-5*H*-6*b*,9-эпоксиизоиндоло[2,1-*a*]хиназолин-10-карбоновой кислоты **4**, пространственное строение которого доказано РСА. Кристаллографические данные для эфира **4** доступны в Кембриджском банке структурных данных (CCDC 844755).



Таким образом, в настоящей работе нами предложен эффективный двустадийный метод синтеза эпоксиизоиндоло[2,1-*a*]хиназолинового скелета, базирующийся на доступном исходном сырье. Установлено пространственное строение аддуктов [4+2]-циклоприсоединения малеинового ангидрида к 2-фурилхиназолинам.

ИК спектры записаны на фурье-спектрометре Инфралюм ФТ-801 в таблетках КВг. Спектры ЯМР ^1H зарегистрированы на приборе Bruker WH-400 (400 МГц) и JEOL JNM-ECA600 (600 МГц) для ~3% растворов в CDCl_3 или DMSO-d_6 , внутренний стандарт – остаточные сигналы растворителей (δ 7.26 м. д. для CHCl_3 и 2.49 м. д. – DMSO). Спектры ЯМР ^{13}C записаны на спектрометре Bruker Avance 600 (150 МГц) и Bruker WH-400 (100 МГц), в качестве стандарта использован центральный сигнал мультиплета DMSO-d_6 (40.0 м. д.) и триплета CDCl_3 (77.4 м. д.). Масс-спектры полученных веществ записаны на масс-спектрометре Thermo Trace DSQ (электронная ионизация 70 эВ, температура в источнике 200 °С, прямой ввод) или хромато-масс-спектрометре Finnegan MAT-95-XL с прямым вводом образца в источник ионов. Температуры плавления синтезированных образцов определены на приборе SMP 30 и не исправлены. Для ТСХ использовали пластины Sorbfil (проявление парами иода), для колоночной хроматографии – Al_2O_3 (активированный, нейтральный, 50–200 меш), элюент EtOAc –гексан, 1:5.

Реактивы фирмы Acros Organics применяли без дополнительной очистки, для синтезов использовали свежеперегнанные растворители.

2-(2-Фурил)-2,3-дигидрохиназолин-4(1H)-оны (1) (общая методика). К раствору 8.15 г (0.050 моль) изатового ангидрида, 4.14 мл (0.050 моль) фурфурола и 0.060 моль соответствующего амина в 100 мл этанола добавляют 4.30 г (0.025 моль) $\text{TsOH}\cdot\text{H}_2\text{O}$ и кипятят 4 ч (контроль ТСХ). Реакционную смесь выливают в 200 мл воды, подщелачивают водным раствором NaHCO_3 , экстрагируют CHCl_3 (3×50 мл). Экстракт сушат безводным MgSO_4 . Остаток после отгонки CHCl_3 очищают колоночной хроматографией. Получают хиназолины **1** в виде бесцветных игл.

2-(2-Фурил)-3-этил-2,3-дигидрохиназолин-4(1H)-он (1a). Выход 4.84 г (40%). Т. пл. 120–121 °С (EtOAc–гексан). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1613 (N–C=O), 3261 (NH). Спектр ЯМР ^1H (600 МГц, CDCl_3), δ , м. д. (J , Гц): 1.21 (3H, т, $J = 7.2$, CH_3); 3.09 (1H, д, к, $J = 7.2$, $J = 14.4$) и 4.05 (1H, д, к, $J = 7.2$, $J = 14.4$, NCH_2); 4.79 (1H, уш. с, NH); 5.72 (1H, д, $J = 2.4$, H-2); 6.19 (1H, уш. д, $J = 3.4$, H-3 Fur); 6.23 (1H, д, д, $J = 1.7$, $J = 3.4$, H-4 Fur); 6.60 (1H, уш. д, $J = 7.9$, H-8); 6.84 (1H, д, т, $J = 1.0$, $J = 7.9$, H-6); 7.25 (1H, д, т, $J = 1.7$, $J = 7.9$, H-7); 7.31 (1H, д, д, $J = 0.7$, $J = 1.7$, H-5 Fur); 7.91 (1H, д, д, $J = 1.7$, $J = 7.9$, H-5). Спектр ЯМР ^{13}C (100 МГц, CDCl_3), δ , м. д.: 13.4 (CH_3); 40.2 (NCH_2); 65.3 (C-2); 108.2 (C-3 Fur); 110.4 (C-8); 114.8 (C-6); 116.7 (C-4a); 119.5 (C-4 Fur); 128.4 (C-5); 133.3 (C-7); 142.9 (C-5 Fur); 145.2 (C-8a); 152.7 (C-2 Fur); 162.8 (NCO). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 242 [$\text{M}]^+$ (100), 211 (31), 197 (14), 170 (33), 147 (22), 130 (16), 119 (25), 92 (28), 76 (17), 64 (28), 39 (14). Найдено, %: C 69.79; H 6.01; N 11.14. $\text{C}_{14}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_2$. Вычислено, %: C 69.41; H 5.82; N 11.56.

2-(2-Фурил)-3-(2-фурилметил)-2,3-дигидрохиназолин-4(1H)-он (1b). Выход 9.25 г (63%). Т. пл. 125–127 °С (EtOAc–гексан). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1628 (N–C=O), 3254 (NH). Спектр ЯМР ^1H (400 МГц, CDCl_3), δ , м. д. (J , Гц): 4.10 (1H, д, $J = 15.6$) и 5.41 (1H, д, $J = 15.6$, NCH_2); 4.82 (1H, уш. с, NH); 5.78 (1H, уш. д, $J = 2.5$, H-3 Fur); 6.14 (1H, уш. д, $J = 3.1$, H-3 Fur); 6.21 (1H, д, д, $J = 1.9$, $J = 3.1$, H-4 Fur); 6.31 (2H, м, H-2, H-4 Fur); 6.60 (1H, д, $J = 8.1$, H-8); 6.84 (1H, т, $J = 8.1$, H-6); 7.24 (1H, т, $J = 8.1$, H-7); 7.29 (1H, уш. с, H-5 Fur); 7.31 (1H, д, $J = 1.9$, H-5 Fur); 7.94 (1H, д, $J = 8.1$, H-5). Спектр ЯМР ^{13}C (150 МГц, CDCl_3), δ , м. д.: 40.6 (NCH_2); 64.8 (C-2); 108.2 (C-3 Fur); 109.0 (C-3 Fur); 110.4 (C-8); 110.6 (C-4 Fur); 115.0 (C-6); 116.0 (C-4a); 119.3 (C-4 Fur); 128.6 (C-5); 133.7 (C-7); 142.7 (C-5 Fur); 143.0 (C-5 Fur); 145.5 (C-8a); 150.3 (C-2 Fur); 152.2 (C-2 Fur); 163.0 (NCO). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 294 [$\text{M}]^+$ (7), 170 (19), 143 (8), 115 (17), 96 (37), 81 (100), 69 (14), 53 (86), 39 (45). Найдено, %: C 69.13; H 4.44; N 9.89. $\text{C}_{17}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_3$. Вычислено, %: C 69.38; H 4.79; N 9.52.

3-Бензил-2-(2-фурил)-2,3-дигидрохиназолин-4(1H)-он (1c). Выход 6.54 г (43%). Т. пл. 175–176 °С (гексан–EtOAc). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1628 (N–C=O), 3245 (NH). Спектр ЯМР ^1H (400 МГц, CDCl_3), δ , м. д. (J , Гц): 3.87 (1H, д, $J = 15.6$) и 5.66 (1H, д, $J = 15.6$, NCH_2); 4.73 (1H, уш. с, NH); 5.58 (1H, с, H-2); 6.16 (1H, д, д, $J = 0.9$, $J = 3.2$, H-3 Fur); 6.21 (1H, д, д, $J = 1.8$, $J = 3.2$, H-4 Fur); 6.58 (1H, д, $J = 7.8$, H-8); 6.84 (1H, т, $J = 7.8$, H-6); 7.28 (7H, м, H-7, H-5 Fur, H Ph); 7.96 (1H, д, $J = 7.8$, H-5). Спектр ЯМР ^{13}C (100 МГц, CDCl_3), δ , м. д.: 47.4 (NCH_2); 64.4 (C-2); 108.2 (C-3 Fur); 110.4 (C-8); 114.8 (C-6); 116.4 (C-4a); 119.8 (C-4 Fur); 127.7; 128.1; 128.7 (C Ph); 128.8 (C-5); 133.6 (C-7); 136.8 (C Ph); 143.1 (C-5 Fur); 145.1 (C-8a); 152.1 (C-2 Fur); 163.1 (NCO). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 304 [$\text{M}]^+$ (100), 273 (67), 196 (29), 169 (9), 140 (8), 91 (36), 65 (21). Найдено, %: C 75.23; H 5.48; N 9.45. $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_2$. Вычислено, %: C 74.98; H 5.30; N 9.20.

6b,9-Эпоксизоиндоло[2,1-*a*]хиназолин-10-карбоновые кислоты (3) (общая методика). Смесь 1.5 ммоль хиназолина **1** и 0.15 г (1.5 ммоль) малеинового ангидрида в 15 мл толуола кипятят 4 ч. Оставляют на ночь при комнатной температуре. Выпавшие кристаллы отфильтровывают, промывают эфиром, сушат на воздухе. Получают аддукты Дильса–Альдера **3** в виде бесцветных порошков.

(6aR*,6bS*,9R*,10S*,10aR*)-5,11-Диоксо-6-этил-6,6a,9,10,10a,11-гексагидро-5H-6b,9-эпоксизоиндоло[2,1-*a*]хиназолин-10-карбоновая кислота (3a). Выход 0.49 г (96%). Т. пл. 204–205 °С (разл.) (2-PrOH–ДМФА). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1618, 1717 (N–C=O), 1723 (O–C=O). Спектр ЯМР ^1H (400 МГц, DMCO-d_6), δ , м. д. (J , Гц): 1.12 (3H, т, $J = 7.2$, CH_3); 2.63 (1H, д, $J = 8.9$, H-10); 3.22 (1H, д, $J = 8.9$, H-10a); 3.24 (1H, д, к, $J = 7.2$, $J = 14.4$) и 3.75 (1H, д, к, $J = 7.2$, $J = 14.4$, NCH_2); 5.17 (1H, д, $J = 1.7$, H-9); 6.23 (1H, с, H-6a); 6.54 (1H, д, д, $J = 1.7$, $J = 5.6$, H-8); 6.82 (1H, д, $J = 5.6$, H-7); 7.24 (1H, д, т, $J = 1.4$, $J = 7.6$, H-3); 7.56 (1H, д, д, д,

$J = 1.7, J = 7.6, J = 7.9, H-2$); 7.91 (1H, д. д, $J = 1.4, J = 7.9, H-1$); 8.18 (1H, уш. д, $J = 7.6, H-4$). Спектр ЯМР ^{13}C (100 МГц, ДМСО- d_6), δ , м. д.: 12.5 (CH₃); 38.1 (NCH₂); 45.8 (C-10); 51.2 (C-10a); 68.9 (C-6a); 82.1 (C-9); 89.3 (C-6b); 118.6 (C-1); 119.3 (C-4a); 124.8 (C-3); 128.6 (C-4); 133.8 (C-7); 134.7 (C-2); 137.4 (C-8,12a); 162.2; 169.6 (NCO); 173.1 (OCO). Масс-спектр, m/z ($I_{отн.}$, %): 340 [M]⁺ (4), 241 (100), 213 (23), 175 (17), 146 (42), 120 (18), 108 (21), 94 (32), 80 (32), 54 (38), 43 (32). Найдено, %: C 63.89; H 5.00; N 8.14. C₁₈H₁₆N₂O₅. Вычислено, %: C 63.53; H 4.74; N 8.23.

(6aR*,6bS*,9R*,10S*,10aR*)-5,11-Диоксо-6-(2-фурилметил)-6,6a,9,10,10a,11-гексагидро-5H-6b,9-эпоксизоиндоло[2,1-a]хиназолин-10-карбоновая кислота (3b). Выход 0.39 г (66%). Т. пл. 195–196 °С (2-PrOH–ДМФА). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1667, 1695 (N–C=O), 1734 (O–C=O). Спектр ЯМР 1H (400 МГц, ДМСО- d_6), δ , м. д. (J , Гц): 2.68 (1H, д, $J = 9.0, H-10$); 3.26 (1H, д, $J = 9.0, H-10a$); 4.20 (1H, д, $J = 16.2$) и 5.29 (1H, д, $J = 16.2, NCH_2$); 5.23 (1H, д, $J = 1.8, H-9$); 6.17 (1H, с, H-6a); 6.36 (1H, д. д, $J = 0.7, J = 3.2, H-3$ Fur); 6.43 (1H, д. д, $J = 1.8, J = 3.2, H-4$ Fur); 6.57 (1H, д. д, $J = 1.8, J = 5.6, H-8$); 6.62 (1H, д, $J = 5.6, H-7$); 7.28 (1H, т, $J = 7.5, H-3$); 7.60 (1H, д. д, $J = 0.7, J = 1.8, H-5$ Fur); 7.61 (1H, д. д. д, $J = 1.2, J = 7.5, J = 8.1, H-2$); 7.95 (1H, д. д, $J = 1.2, J = 7.5, H-4$); 8.19 (1H, уш. д, $J = 8.1, H-1$). Спектр ЯМР ^{13}C (100 МГц, ДМСО- d_6), δ , м. д.: 38.5 (NCH₂); 45.3 (C-10); 50.6 (C-10a); 68.6 (C-6a); 81.6 (C-9); 88.5 (C-6b); 108.4 (C-3 Fur); 110.5 (C-4 Fur); 118.2 (C-1); 118.3 (C-4a); 124.4 (C-3); 128.3 (C-4); 133.5 (C-7); 134.3 (C-2); 136.5 (C-8); 136.9 (C-12a); 142.6 (C-5 Fur); 149.8 (C-2 Fur); 161.7; 168.9 (NCO); 172.4 (OCO). Масс-спектр, m/z ($I_{отн.}$, %): 392 [M]⁺ (5), 294 (74), 252 (11), 198 (69), 170 (51), 143 (32), 119 (26), 96 (100), 80 (98), 65 (14), 53 (53), 43 (55). Найдено, %: C 64.01; H 4.42; N 7.45. C₂₁H₁₆N₂O₆. Вычислено, %: C 64.28; H 4.11; N 7.14.

(6aR*,6bS*,9R*,10S*,10aR*)-6-Бензил-5,11-диоксо-6,6a,9,10,10a,11-гексагидро-5H-6b,9-эпоксизоиндоло[2,1-a]хиназолин-10-карбоновая кислота (3c). Выход 0.50 г (83%). Т. пл. 202–203 °С (2-PrOH–ДМФА). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1665, 1702 (N–C=O), 1744 (O–C=O). Спектр ЯМР 1H (400 МГц, ДМСО- d_6), δ , м. д. (J , Гц): 2.63 (1H, д, $J = 9.3, H-10$); 3.18 (1H, д, $J = 9.3, H-10a$); 4.30 (1H, д, $J = 16.2$) и 5.38 (1H, д, $J = 16.2, NCH_2$); 5.21 (1H, д, $J = 1.4, H-9$); 6.21 (1H, с, H-6a); 6.27 (1H, д, $J = 5.6, H-7$); 6.53 (1H, д. д, $J = 1.4, J = 5.6, H-8$); 7.22–7.38 (6H, м, H-3, H Ph); 7.64 (1H, т, $J = 8.1, H-2$); 8.03 (1H, д. д, $J = 1.2, J = 8.1, H-4$); 8.23 (1H, д, $J = 8.1, H-1$). Спектр ЯМР ^{13}C (150 МГц, ДМСО- d_6), δ , м. д.: 45.9 (NCH₂); 46.0 (C-10); 51.2 (C-10a); 69.0 (C-6a); 82.3 (C-9); 89.2 (C-6b); 118.9 (C-4a); 119.0 (C-1); 125.0 (C-3); 127.7 (C-3',4',5'); 129.0 (C-4); 129.1 (C-2',6'); 134.1 (C-7); 134.5 (C-2); 136.5 (C-8); 137.1 (C-1'); 137.5 (C-12a); 162.6; 169.6 (NCO); 173.1 (OCO). Масс-спектр, m/z ($I_{отн.}$, %): 402 [M]⁺ (8), 304 (51), 237 (17), 213 (100), 198 (42), 186 (12), 170 (75), 143 (34), 130 (14), 119 (55), 106 (78), 92 (72), 76 (37), 54 (66), 43 (53). Найдено, %: C 68.78; H 4.40; N 7.13. C₂₃H₁₈N₂O₅. Вычислено, %: C 68.65; H 4.51; N 6.96.

Метилловый эфир (6aR*,6bS*,9R*,10S*,10aR*)-6-(2-фурилметил)-5,11-диоксо-6,6a,9,10,10a,11-гексагидро-5H-6b,9-эпоксизоиндоло[2,1-a]хиназолин-10-карбоновой кислоты (4). Выход 0.29 г (72%). Бесцветные иглы, т. пл. 235–237 °С (EtOAc–EtOH). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1661 (N–C=O), 1726 (O–C=O). Спектр ЯМР 1H (400 МГц, CDCl₃), δ , м. д. (J , Гц): 2.84 (1H, д, $J = 8.7, H-10$); 3.06 (1H, д, $J = 8.7, H-10a$); 3.76 (3H, с, CH₃); 4.25 (1H, д, $J = 16.2$) и 5.49 (1H, д, $J = 16.2, NCH_2$); 5.35 (1H, д, $J = 1.2, H-9$); 6.05 (1H, с, H-6a); 6.33 (2H, уш. с, H-3,4 Fur); 6.51 (1H, д. д, $J = 1.2, J = 5.6, H-8$); 6.76 (1H, д, $J = 5.6, H-7$); 7.20 (1H, т, $J = 7.5, H-3$); 7.33 (1H, уш. с, H-5 Fur); 7.48 (1H, д. д. д, $J = 1.2, J = 7.5, J = 8.1, H-2$); 8.07 (1H, д. д, $J = 1.2, J = 7.5, H-4$); 8.18 (1H, уш. д, $J = 8.1, H-1$). Спектр ЯМР ^{13}C (100 МГц, CDCl₃), δ , м. д.: 38.8 (NCH₂); 45.8 (C-10); 51.4 (C-10a); 52.6 (OCH₃); 69.4 (C-6a); 81.8 (C-9); 88.9 (C-6b); 109.2 (C-3 Fur); 110.8 (C-4 Fur); 118.9 (C-1); 119.0 (C-4a); 125.0 (C-3); 129.2 (C-4); 133.7 (C-7); 135.1 (C-2); 136.3 (C-8); 136.6 (C-12a); 142.2

(C-5 Fur); 150.6 (C-2 Fur); 162.5; 168.3 (NCO); 171.6 (OCO). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 406 $[M]^+$ (42), 293 (58), 252 (33), 232 (10), 198 (100), 175 (23), 146 (19), 113 (63), 80 (98), 53 (37), 43 (37). Найдено, %: С 65.11; Н 4.55; N 7.01. $C_{22}H_{18}N_2O_6$. Вычислено, %: С 65.02; Н 4.46; N 6.89.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований, грант 10-03-00177а. Авторы выражают благодарность сотрудникам лаборатории Центра прецизионных инструментальных методов анализа "ПРИМА" ЦКП РУДН за проведение спектральных исследований.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. F. I. Zubkov, I. K. Airiyan, A. A. Dzyubenko, N. I. Yudina, V. P. Zaytsev, E. V. Nikitina, A. V. Varlamov, V. N. Khrustalev, D. G. Grudinin, *J. Heterocycl. Chem.*, **47**, 400 (2010).
2. M. Baghbanzadeh, P. Salehi, M. Dabiri, G. Kozehgary, *Synthesis*, 344 (2006).
3. F. I. Zubkov, J. D. Ershova, A. A. Orlova, V. P. Zaytsev, E. V. Nikitina, A. S. Peregudov, A. V. Gurbanov, R. S. Borisov, V. N. Khrustalev, A. M. Maharramov, A. V. Varlamov, *Tetrahedron*, **65**, 3789 (2009).
4. F. I. Zubkov, I. K. Airiyan, K. F. Turchin, V. P. Zaytsev, A. V. Gurbanov, A. M. Maharramov, V. N. Khrustalev, A. S. Peregudov, E. V. Nikitina, A. V. Varlamov, *Synthesis*, 4235 (2009).

В. П. Зайцев*, **Ф. И. Зубков**, **Е. Л. Моторыгина**,
М. Г. Горбачева, **Е. В. Никитина**, **А. В. Варламов**

Российский университет дружбы народов,
ул. Миклухо-Маклая, 6, Москва 117198, Россия
e-mail: vzaitsev@sci.pfu.edu.ru

Поступило 20.09.2011

ХГС. – 2011. – № 12. – С. 1909

СИНТЕЗ НОВОЙ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ НАФТО[1,2-*e*][1,2,4]ТРИАЗОЛО[5,1-*b*][1,3]ОКСАЗИНА

Ключевые слова: 3,5-дибром-1,2,4-триазол, *o*-метиленихиноны, нафто[1,2-*e*]-[1,2,4]триазоло[5,1-*b*][1,3]оксазины, основания Манниха.

Конденсированные 1,2,4-триазолы нашли применение в медицине и ветеринарии в качестве транквилизаторов [1], фунгицидов [2], антигистаминных [3] и антигипертензивных [4] препаратов. В продолжение исследований по изучению синтетического потенциала *o*-метиленихинонов нафталинового ряда в синтезе конденсированных азоло-1,3-оксазинов [5], мы осуществили одностадийный синтез нафто[1,2-*e*][1,2,4]триазоло[5,1-*b*]-[1,3]оксазинов **2a, b** из 3,5-дибром-1,2,4-триазола и основания Манниха **1b** или его кватернизованного аналога **1a** в присутствии K_2CO_3 . Также мы обнаружили, что в отсутствие K_2CO_3 из производного **1a** в кипящем водном