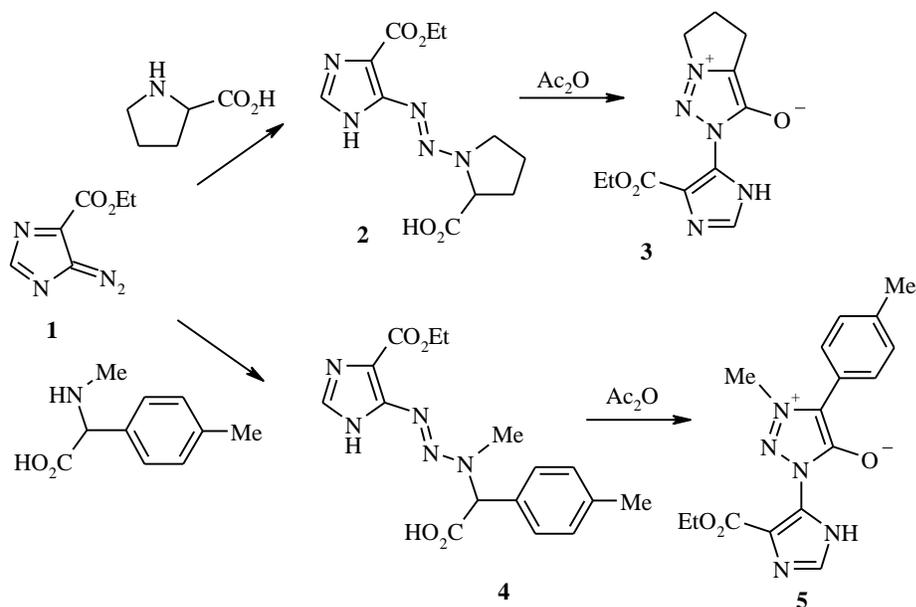


## 2,4,5,6-ТЕТРАГИДРОПИРРОЛО[1,2-с][1,2,3]ТРИАЗОЛИО-5-ОЛАТА

**Ключевые слова:** диазосоединения, имидазол, пиррол, триазены, 1,2,3-триазол, цвиттер-ионные гетероциклы, внутримолекулярное ацилирование.

Продолжая исследования в области конденсированных цвиттер-ионных производных 1,2,3-триазола [1–2] мы предложили простой и удобный метод синтеза 1-имидазолилпирроло[1,2-с][1,2,3]триазолио-5-олата. Реакцией азосочетания 5-диазоимидазола **1** с пролином был получен триазен **2** [3], выделенный в виде двух изомеров относительно связи N=N.



Реакция внутримолекулярного ацилирования в уксусном ангидриде приводит к образованию пирроло[1,2-с][1,2,3]триазолио-5-олату **3**. Циклизация триазена **4**, полученного из *n*-толил-*N*-метилглицина и имидазола **1**, приводит к цвиттер-ионному триазолу **5**.

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  снимали в ДМСО- $d_6$ , внутренний стандарт ТМС.

**1-(4-Этоксикарбонилимидазол-1-ил)-2,4,5,6-тетрагидропирроло[1,2-с][1,2,3]триазолио-5-олат (3).** К раствору 0.21 г (1.1 ммоль) этилового эфира 5-аминоимидазол-4-карбоновой кислоты в 27 мл 0.1 н. HCl при 0–5 °С и перемешивании добавляют по каплям раствор 0.186 г (2.7 ммоль) нитрита натрия в 10 мл воды. Окончание реакции контролируют по иодкрахмальной бумаге. Полученный желтый раствор диазосоединения **1** добавляют к раствору 0.287 г (1.1 ммоль) пролина в 10 мл 1 н. NaOH при охлаждении до 0–5 °С. Раствор становится темно-красным, его подкисляют до pH 4 конц. HCl и выпавший осадок отфильтровывают. Полученный триазен **2** растворяют в 5 мл пиридина и 5 мл Ac<sub>2</sub>O, перемешивают 15 ч при ~20 °С и затем выливают на лед. Выпавший осадок отфильтровывают, перекристаллизовывают из спирта и получают соединение **3**. Выход 0.225 г (78%). Т. пл. 132 °С. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (400 МГц),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 13.5 (1H, уш. с, NH); 7.95 (1H, с, CH); 4.37 (2H, т, *J* = 7.5, CH<sub>2</sub>); 4.15 (2H, к, *J* = 7.1, OCH<sub>2</sub>); 2.78 (2H, т, *J* = 7.2, CH<sub>2</sub>); 2.59 (2H, т, т, *J* = 7.5, *J* = 7.2, CH<sub>2</sub>); 1.15 (3H, т, *J* = 7.1, CH<sub>3</sub>). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 263 (57), 218 (10), 191 (23), 167 (100). Найдено, %: N 26.8. C<sub>11</sub>H<sub>13</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: N 26.60.

**3-Метил-4-*n*-толил-1-(4-этоксикарбонилимидазол-1-ил)[1,2,3]триазолио-5-олат (5)** получают аналогично из *n*-толил-*N*-метилглицина. Выход 0.295 г (82%). Т. пл. 168 °С. Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (250 МГц),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 13.8 (1H, уш. с, NH); 7.79 (1H, с, CH); 7.60 (2H, д, *J* = 7.9, ArH); 7.25 (2H, д, *J* = 7.9, ArH); 4.20 (2H, к, *J* = 6.7, OCH<sub>2</sub>); 4.13 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.39 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 1.17 (3H, т, *J* = 6.7, CH<sub>3</sub>). Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): 327 (26), 281 (4), 255 (7), 217 (2), 167 (4), 155 (9). Найдено, %: N 21.6. C<sub>16</sub>H<sub>17</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>. Вычислено, %: N 21.39.

*Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (04-03-96104-р, 04-03-96116-р).*

1. Ю. И. Нейн, Ю. Ю. Моржерин, Ю. А. Розин, В. А. Бакулев, *ХГС*, 1302 (2002).
2. E. A. Savel'eva, Yu. A. Rozin, M. I. Kodess, L. Van Meervelt, W. Dehaen, Yu. Yu. Morzherin, V. A. Bakulev, *Tetrahedron*, **60**, 5267 (2004).
3. В. И. Нифонтов, Н. П. Бельская, В. А. Чернов, И. В. Галямова, Н. М. Хворова, М. А. Смалько, Л. В. Крупнова, Е. П. Дариенко, *Хим.-фарм. журн.*, 901 (1988).

Ю. И. Нейн, Т. А. Поспелова, В. А. Бакулев,  
Ю. Ю. Моржерин

Уральский государственный  
технический университет (УПИ),  
Екатеринбург 620002, Россия  
e-mail: [morzherin@htf.ustu.ru](mailto:morzherin@htf.ustu.ru)

Поступило в редакцию 27.09.2004

ХГС. – 2005. – № 7. – С. 1107

---