

И. Стракова, М. Петрова, А. Страков

РЕАКЦИИ 2-АМИНО-4-МЕТИЛ-6-(2-ПИРИДИЛ)- И 2-АМИНО-4-МЕТИЛ-6-ФЕНИЛ-7,8-ДИГИДРОИНДАЗОЛО[4,5-*d*]ТИАЗОЛОВ С АЛЬДЕГИДАМИ

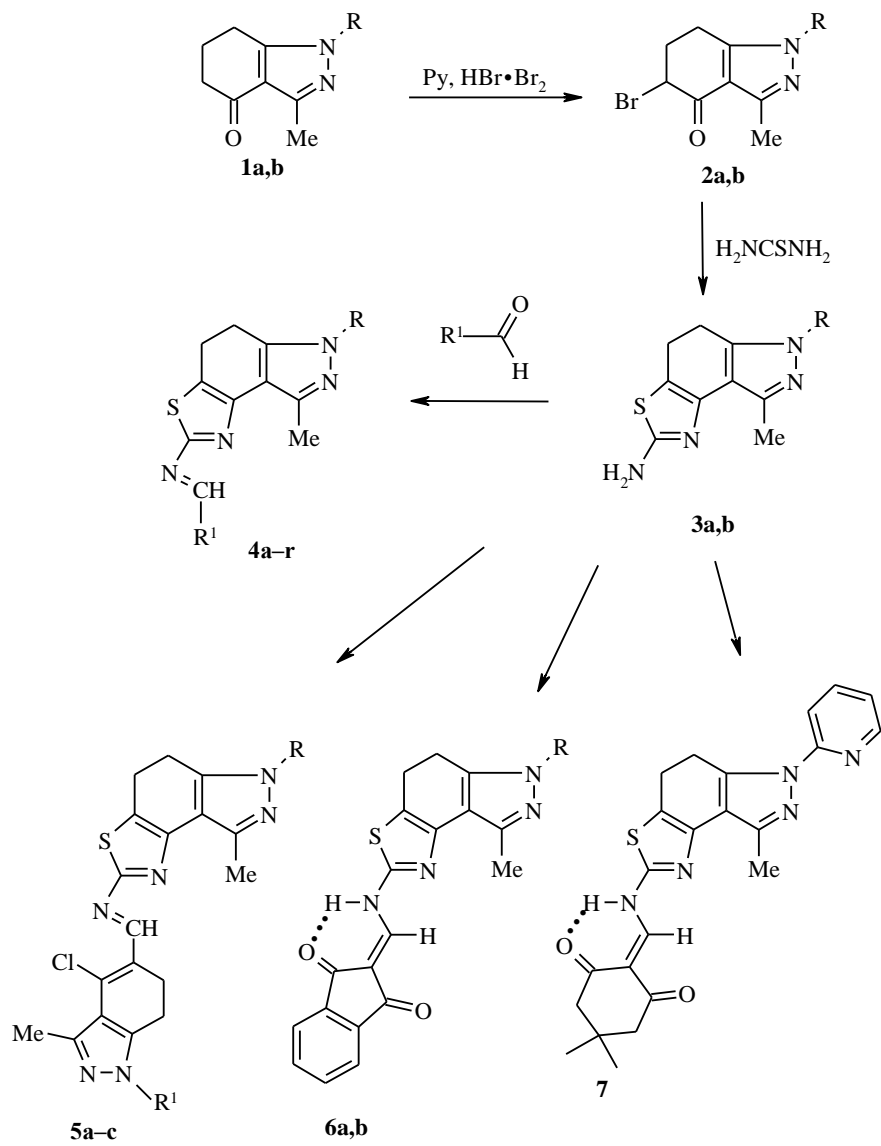
В реакциях 2-амино-4-метил-6-(2-пиридил)-7,8-дигидроиндазола[4,5-*d*]тиазола, полученного обработкой 3-метил-4-оксо-1-(2-пиридил)-4,5,6,7-тетрагидроиндазола пербромидом пиридинийбромидом и последующим действием тиомочевины, а также 2-амино-4-метил-6-фенил-7,8-дигидроиндазола[4,5-*d*]тиазола с 4-бром-, 4-фтор-, 4-диметиламино-, 4-метокси-, 3,4-диметокси-, 3,4-метилендиоксibenзальдегидами, фурфуролом, карбальдегидами пиридина и тиофена получены соответствующие шиффовы основания. Получены также продукты конденсации упомянутых выше аминотиазолов с коричневым альдегидом, 1-(2-пиридил)- и 1-(2,4-дифторфенил)-3-метил-5-формил-4-хлор-6,7-дигидроиндазолами, 2-формилдимедоном и 2-формил-1,3-индандионом.

Ключевые слова: 2-амино-4-метил-6-(2-пиридил)- и 2-амино-4-метил-6-фенил-7,8-дигидроиндазола[4,5-*d*]тиазолы, ароматические альдегиды, 2-формил-1,3-цикландионы, шиффовы основания.

По схеме работы [1] мы синтезировали 2-амино-4-метил-6-(2-пиридил)-7,8-дигидроиндазола[4,5-*d*]тиазол (**3a**). Для этого 3-метил-4-оксо-1-(2-пиридил)-4,5,6,7-тетрагидроиндазол (**1a**) [2] бромировали пербромидом пиридинийбромидом и полученное 5-бромпроизводное **2a** вводили в реакцию с тиомочевинной.

Гидрированные по карбоциклической части индазолы и бензтиазолы, а также трициклические конденсированные системы, включающие фрагмент гидрированного индазола или бензтиазола, в последние годы, благодаря их биологической активности, усиленно изучаются [3–6]. Для модифицирования аминотиазолов **3** мы применяли конденсации с различного типа альдегидами, используя замещенные бензальдегиды, карбальдегиды пиридина и тиофена, фурфурол, коричневый альдегид. Мы провели также конденсации с 1-(2-пиридил)- и 1-(2,4-дифторфенил)-3-метил-5-формил-4-хлор-6,7-дигидроиндазолами, 2-формилдимедоном и 2-формил-1,3-индандионом.

В спектрах ЯМР ^1H соединения **3a** сигнал протонов первичной аминогруппы наблюдается при 4.98, сигналы азометиновых протонов шиффовых оснований соединений **4** – в области 8.71–9.13, соединений **5** – при 9.16 м. д. В спектрах ЯМР ^1H продуктов конденсации аминов **3** с 2-формил-1,3-цикландионами четко прослеживаются сигналы протонов *транс*-фиксированного аминометиленового структурного фрагмента (δ_{CH} 8.42–8.52 м. д., $^3J = 12$ Гц, δ_{NH} 11.36–11.39 м. д., $^3J = 12$ Гц). Химические сдвиги протонов других структурных частей соединений **4–6** подтверждают предложенные структуры. Полоса валентных колебаний карбонильной группы α -бромкетона **2a** в ИК спектре наблюдается при 1680, а валентных колебаний первичной аминогруппы соединения **3a** при 3320 и 3410 cm^{-1} .



1-3, 6 a R = 2-Py; **b** R = Ph; **4 a-g** R = 2-Py, **h-r** R = Ph; **a** R¹ = Ph; **b** R¹ = *p*-BrC₆H₄;
c R¹ = *p*-FC₆H₄; **d** R¹ = 3-Py; **e** R¹ = 2-фурил; **f** R¹ = 2-тиенил; **g** R¹ = Ph-CH=CH-;
h R¹ = *p*-BrC₆H₄; **i** R¹ = *p*-FC₆H₄; **j** R¹ = *p*-Me₂NC₆H₄; **k** R¹ = *p*-MeOC₆H₄;
l R¹ = 3,4-(MeO)₂C₆H₄; **m** R¹ = 3,4-O(CH₂)C₆H₃; **n** R¹ = 3-Py; **o** R¹ = 4-Py; **p** R¹ = 2-фурил;
q R¹ = 2-тиенил; **r** R¹ = Ph-CH=CH-; **5 a, b** R = Ph, **c** R = 2-Py, **a** R¹ = 2,4-F₂C₆H₃;
b, c R¹ = 2-Py

Характеристики соединений 4–7

| Соединение | Брутто формула | Найдено, % Вычислено, % | | | | Т. пл., °С | Выход, % |
|------------|---|----------------------------|------|-------|-------|------------|----------|
| | | С | Н | Н | С | | |
| 4a | C ₂₁ H ₁₇ N ₅ S | 67.77 | 4.60 | 18.92 | 8.40 | 177–179 | 81 |
| | | 67.90 | 4.61 | 18.86 | 8.63 | | |
| 4b | C ₂₁ H ₁₆ BrN ₅ S | 55.81 | 3.52 | 17.61 | | 250–251 | 66 |
| | | 56.00 | 3.58 | 17.74 | | | |
| 4c | C ₂₁ H ₁₆ FN ₅ S | 64.59 | 4.20 | 17.83 | | 239–240 | 77 |
| | | 64.76 | 4.14 | 17.98 | | | |
| 4d | C ₂₀ H ₁₆ N ₆ S | 64.61 | 4.30 | 22.44 | 8.80 | 185–186 | 27 |
| | | 64.50 | 4.33 | 22.57 | 8.61 | | |
| 4e | C ₁₉ H ₁₅ N ₅ OS | 63.01 | 4.14 | 19.30 | 8.90 | 184–185 | 94 |
| | | 63.14 | 4.18 | 19.38 | 8.87 | | |
| 4f | C ₁₉ H ₁₅ N ₅ S ₂ | 60.33 | 3.95 | 18.50 | 17.20 | 211–212 | 56 |
| | | 60.45 | 4.01 | 18.56 | 16.99 | | |
| 4g | C ₂₃ H ₁₉ N ₅ S | 69.40 | 4.77 | 17.75 | 8.20 | 187–188 | 75 |
| | | 69.50 | 4.82 | 17.62 | 8.07 | | |
| 4h | C ₂₂ H ₁₇ BrN ₄ S | 58.61 | 3.76 | 12.32 | | 192–193 | 44 |
| | | 58.80 | 3.81 | 12.47 | | | |
| 4i | C ₂₂ H ₁₇ FN ₄ S ₂ | 67.90 | 4.38 | 14.31 | | 198–200 | 51 |
| | | 68.02 | 4.41 | 14.42 | | | |
| 4j | C ₂₄ H ₂₃ N ₅ S | 69.61 | 5.64 | 16.80 | 7.60 | 216–217 | 29 |
| | | 69.70 | 5.61 | 16.94 | 7.75 | | |
| 4k | C ₂₃ H ₂₀ N ₄ OS | 68.84 | 4.89 | 14.06 | 8.10 | 174–175 | 25 |
| | | 68.97 | 5.03 | 13.99 | 8.01 | | |
| 4l | C ₂₄ H ₂₂ N ₄ O ₂ S | 66.80 | 5.08 | 13.03 | 7.50 | 163–164 | 47 |
| | | 66.95 | 5.15 | 13.01 | 7.45 | | |
| 4m | C ₂₃ H ₁₈ N ₄ O ₂ S | 66.52 | 4.30 | 13.40 | 7.60 | 183–185 | 24 |
| | | 66.65 | 4.38 | 13.52 | 7.74 | | |
| 4n | C ₂₁ H ₁₇ N ₅ S | 67.71 | 4.48 | 18.66 | 8.50 | 176–177 | 41 |
| | | 67.90 | 4.61 | 18.86 | 8.63 | | |
| 4o | C ₂₁ H ₁₇ N ₅ S | 67.77 | 4.55 | 18.69 | 8.70 | 202–205 | 27 |
| | | 67.90 | 4.61 | 18.86 | 8.63 | | |
| 4p | C ₂₀ H ₁₆ N ₄ OS | 66.73 | 4.42 | 15.65 | 8.80 | 164–165 | 84 |
| | | 66.64 | 4.48 | 15.55 | 8.90 | | |
| 4q | C ₂₀ H ₁₆ N ₄ S ₂ | 63.70 | 4.35 | 14.80 | 16.80 | 168–169 | 66 |
| | | 63.80 | 4.28 | 14.88 | 17.03 | | |
| 4r | C ₂₄ H ₂₀ N ₄ S | 72.77 | 4.95 | 14.02 | 7.90 | 176–178 | 50 |
| | | 72.70 | 5.08 | 14.13 | 8.09 | | |
| 5a | C ₃₀ H ₂₃ ClF ₂ N ₆ S | 62.68 | 4.00 | 14.55 | | 213–215 | 53 |
| | | 62.88 | 4.03 | 14.67 | | | |
| 5b | C ₂₉ H ₂₄ ClN ₇ S | 64.80 | 4.45 | 18.10 | | 173–176 | 74 |
| | | 64.73 | 4.50 | 18.22 | | | |
| 5c | C ₂₈ H ₂₃ ClN ₈ S | 62.31 | 4.34 | 20.71 | | 261–263 | 83 |
| | | 62.39 | 4.30 | 20.79 | | | |
| 6a | C ₂₄ H ₁₇ N ₅ O ₂ S | 65.42 | 3.79 | 15.82 | 7.20 | 300–305 | 74 |
| | | 65.59 | 3.90 | 15.94 | 7.29 | | |
| 6b | C ₂₅ H ₁₈ N ₄ O ₂ S | 68.36 | 4.09 | 12.62 | 7.20 | 272–273 | 81 |
| | | 68.48 | 3.14 | 12.78 | 7.31 | | |
| 7 | C ₂₃ H ₂₃ N ₅ O ₂ S | 63.60 | 5.30 | 16.11 | 7.50 | 224–225 | 93 |
| | | 63.72 | 5.35 | 16.16 | 7.40 | | |

Спектры ЯМР ^1H синтезированных соединений

| Соединение | Химические сдвиги, δ , м. д. (КССВ, J, Гц)* |
|------------|---|
| 2a | 2.47 (2H, м, CH ₂); 2.53 (2H, с, CH ₃); 3.53 (2H, м, CH ₂); 4.46 (1H, т, $^3J = 3$, CH); 7.21 (1H, м, Ar); 7.78–7.89 (2H, м, Ar); 7.91 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar) |
| 3a | 2.51 (3H, м, CH ₃); 2.91 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.58 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 4.98 (2H, уш. с, NH ₂); 7.02 (1H, м, Ar); 7.71–7.91 (2H, м, Ar); 8.33 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1$, Ar) |
| 4a | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.09 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.07 (1H, д, д, д, $^3J = 5$, $^3J = 6$, $^4J = 1$, Ar); 7.02 (1H, м, Ar); 7.38–7.91 (7H, м, Ar); 8.31 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1$, Ar); 8.91 (1H, с, =CH–) |
| 4b | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.13 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.13 (1H, м, Ar); 7.49–7.96 (6H, м, Ar); 8.36 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 8.93 (1H, с, =CH–) |
| 4c | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.09 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.09–7.85 (7H, м, Ar); 8.33 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1$, Ar); 8.96 (1H, с, =CH–) |
| 4d | 2.58 (3H, с, CH ₃); 3.13 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.58 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.07–8.31 (7H, м, Ar); 8.64 (1H, д, $^3J = 5$, Ar); 9.02 (2H, с, =CH–) |
| 4e | 2.61 (3H, с, CH ₃); 3.09 (2H, м, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, м, $^3J = 7$, CH ₂); 6.53 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 7.07 (2H, м, Ar); 7.60 (1H, д, $^4J = 1.5$, Ar); 7.71 (1H, д, $^3J = 7$, $^4J = 1.5$, Ar); 7.89 (1H, д, $^3J = 8$, Ar); 8.33 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 8.87 (1H, с, =CH) |
| 4f | 2.61 (3H, с, CH ₃); 3.07 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.58 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.11–7.93 (6H, м, Ar); 8.33 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 9.08 (1H, с, =CH–) |
| 4g | 2.65 (3H, с, CH ₃); 3.09 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.13–7.86 (10H, м, Ar); 8.38 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1$, Ar); 8.71 (1H, д, $^3J = 8$, =CH–) |
| 4h | 2.61 (3H, с, CH ₃); 3.02 (4H, с, 2CH ₂); 7.36 (5H, м, Ar); 7.51 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 7.82 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 8.89 (1H, с, =CH–) |
| 4i | 2.64 (3H, с, CH ₃); 3.09 (4H, с, 2CH ₂); 7.11–7.47 (7H, м, Ar); 7.91 (2H, м, Ar); 8.93 (1H, с, =CH–) |
| 4j | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.02 (4H, с, 2CH ₂); 3.06 (6H, с, N(CH ₃) ₂); 6.62 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 7.38 (5H, м, Ar); 7.78 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 8.71 (1H, с, =CH–) |
| 4k | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.02 (4H, с, 2CH ₂); 3.82 (3H, с, CH ₃); 6.89 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 7.38 (5H, м, Ar); 7.89 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 8.78 (1H, с, =CH–) |
| 4l | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.04 (4H, с, 2CH ₂); 3.89 (3H, с, OCH ₃); 3.94 (3H, с, OCH ₃); 6.86 (1H, д, $^3J = 8$, Ar); 7.41 (6H, м, Ar); 7.62 (1H, д, $^4J = 2$, Ar); 8.81 (1H, с, =CH–) |
| 4m | 2.58 (3H, с, CH ₃); 3.01 (4H, с, 2CH ₂); 5.96 (2H, с, CH ₂); 6.82 (2H, м, $^3J = 8$, Ar); 7.36–7.51 (6H, м, Ar); 8.78 (1H, с, =CH–) |
| 4n | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.09 (4H, с, 2CH ₂); 7.38 (6H, м, Ar); 8.29 (1H, д, т, $^3J = 8$, $^4J = 1.5$, Ar); 8.69 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 9.01 (1H, д, $^4J = 1.5$, Ar); 9.04 (1H, с, =CH–) |
| 4o | 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.13 (4H, с, 2CH ₂); 7.42 (5H, м, Ar); 7.81 (2H, м, $^3J = 5$, Ar); 8.69 (2H, м, $^3J = 5$, Ar); 9.06 (1H, с, =CH–) |
| 4p | 2.58 (3H, с, CH ₃); 3.04 (4H, с, 2CH ₂); 6.56 (1H, д, д, $^3J = 4$, $^4J = 2$, Ar); 7.07 (1H, д, $^3J = 4$, Ar); 7.12–7.47 (5H, м, Ar); 7.61 (1H, д, $^4J = 2$, Ar); 8.91 (1H, с, =CH–) |
| 4q | 2.58 (3H, с, CH ₃); 3.02 (4H, с, 2CH ₂); 7.07–7.58 (8H, м, Ar); 9.07 (1H, с, =CH–) |
| 4r | 2.42 (3H, с, CH ₃); 3.04 (4H, с, 2CH ₂); 7.16–7.53 (12H, м, Ar, 2=CH–); 8.71 (1H, д, $^3J = 9$, =CH–) |
| 5a | 2.51 (3H, с, CH ₃); 2.62 (4H, с, 2CH ₂); 2.63–3.02 (4H, м, 2CH ₂); 3.04 (3H, с, CH ₃); 6.91–7.49 (8H, м, Ar); 9.16 (1H, с, =CH–) |
| 5b | 2.49 (3H, с, CH ₃); 2.58 (3H, с, CH ₃); 2.96 (4H, с, 2CH ₂); 2.98–3.38 (4H, м, 2CH ₂); 7.13–7.91 (8H, м, Ar); 8.36 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 9.16 (1H, с, =CH–) |
| 5c | 2.53 (3H, с, CH ₃); 2.62 (3H, с, CH ₃); 3.01–3.71 (8H, м, 4CH ₂); 7.13 (3H, м, Ar); 7.82 (4H, м, Ar); 8.36 (2H, м, Ar); 9.16 (1H, с, =CH–) |
| 6a | 2.61 (3H, с, CH ₃); 3.04 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.64 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.11 (1H, м, Ar); 7.82 (6H, м, Ar); 8.35 (1H, м, Ar); 8.42 (1H, д, $^3J = 12$, =CH–); 11.36 (1H, д, $^3J = 12$, NH) |
| 6b | 2.63 (3H, с, CH ₃); 3.08 (4H, с, 2CH ₂); 7.43–7.78 (9H, м, Ar); 8.52 (1H, д, $^3J = 12$, =CH–); 11.39 (1H, д, $^3J = 12$, NH) |
| 7 | 1.02 (6H, с, 2CH ₃); 2.36 (2H, с, CH ₂); 2.38 (2H, с, CH ₂); 2.51 (3H, с, CH ₃); 3.04 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 3.62 (2H, т, $^3J = 7$, CH ₂); 7.04 (1H, д, д, д, $^2J = 5$, $^3J = 7$, $^4J = 1.5$, Ar); 7.69 (1H, д, т, $^3J = 7$, $^4J = 1.5$, Ar); 7.89 (1H, д, д, $^3J = 7$, $^4J = 1.5$, Ar); 8.31 (1H, д, д, $^3J = 5$, $^4J = 1.5$, Ar); 8.67 (1H, д, $^3J = 13$, =CH–); 12.16 (1H, д, $^3J = 13$, NH) |

* Спектры ЯМР ^1H соединений **4e,i,l,p,q** снимали в ДМСО- d_6 , остальных соединений – в CDCl₃.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ^1H регистрировали на спектрометре Bruker WH 90/DS (90 МГц). Внутренний стандарт ТМС. ИК спектры получали на приборе Specord IR-75 для суспензий веществ в вазелиновом масле (область $1800\text{--}1500\text{ см}^{-1}$) и гексахлорбутадиене ($3600\text{--}2000\text{ см}^{-1}$).

В работе использовали альдегиды фирмы "Acros". Характеристики соединений **4–7** приведены в табл. 1 и 2.

Соединение **1a** синтезировали по методике, приведенной в работе [2], 2-амино-6-фенил-7,8-дигидроиндазол[4,5-*d*]тиазол – по методике работы [1].

5-Бром-3-метил-4-оксо-1-(2-пиридил)-4,5,6,7-тетрагидроиндазол (2a). К раствору 2.27 г индазола **1a** в 30 мл (10 ммоль) уксусной кислоты добавляют раствор 3.20 г (10 ммоль) перброма пиридинийброма в 50 мл уксусной кислоты, кипятят 20 мин и к горячей реакционной смеси добавляют 100 мл воды. Образовавшееся смолообразное быстро затвердевающее вещество отфильтровывают и перекристаллизовывают из смеси этанол–вода, 2:1. Выход 1.71 г (56 %). Т. пл. $121\text{--}122\text{ }^\circ\text{C}$. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1680 (C=O). Найдено, %: C 51.11; H 4.02; Br 25.90; N 13.55. $\text{C}_{13}\text{H}_{12}\text{BrN}_3\text{O}$. Вычислено, %: C 51.00; H 3.95; Br 26.10; N 13.73.

2-Амино-4-метил-6-(2-пиридил)-7,8-дигидроиндазол[4,5-*d*]тиазол (3a). Кипятят 1.54 г (5 ммоль) бромкетона **2a** и 0.38 г (5 ммоль) тиомочевины в 40 мл этанола в течение 14 ч. Охлаждают, приливают 80 мл воды и 2 мл концентрированного раствора NH_4OH . Выпавший осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из разбавленного этанола, 2:1. Выход соединения **3a** 1.02 г (72%). Т. пл. $106\text{--}108\text{ }^\circ\text{C}$. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3320, 3410 (NH). Найдено, %: C 59.22; H 4.50; N 24.60; S 11.20. $\text{C}_{14}\text{H}_{13}\text{N}_5\text{S}$. Вычислено, %: C 59.34; H 4.62; N 24.72; S 11.32.

2-Бензальамино- (4a), 2-(4-бромбензаль)амино- (4b), 2-(4-фторбензаль)амино- (4c), 2-(3-пиридилметил)амино- (4d), 2-(2-фурилметил)амино- (4e), 2-(2-тиенилметил)амино- (4f), 2-(3-фенилпроп-2-ен-1-илиден)амино- (4g) -4-метил-6-(2-пиридил)-7,8-дигидроиндазол[4,5-*d*]тиазолы, 2-(4-бромбензаль)амино- (4h), 2-(4-фторбензаль)амино- (4i), 2-(4-диметиламинобензаль)амино- (4j), 2-(4-метоксибензаль)амино- (4k), 2-(3,4-диметоксибензаль)амино- (4l), 2-(3,4-метилendioксибензаль)амино- (4m), 2-(3-пиридилметил)амино- (4n), 2-(4-пиридилметил)амино- (4o), 2-(2-фурилметил)амино- (4p), 2-(2-тиенилметил)амино- (4q) и 2-(3-фенилпроп-2-ен-1-илиден)амино- (4r) -4-метил-6-фенил-7,8-дигидроиндазол[4,5-*d*]тиазолы. Сливают горячие растворы 2 ммоль соответствующего аминотиазола (**3a,b**) в 20 мл этанола и эквимолярного количества альдегида в 10 мл этанола и кипятят 4 ч. Оставляют на 1 сут в холодильнике, осадок соединения **4** отфильтровывают и перекристаллизовывают **4a,d,k–r** из этанола, **4b,c,h–j** – из ДМФА, **4e–g** – из смеси этанол–ДМФА.

2-[3-Метил-1-(2,4-дифторфенил)-4-хлор-6,7-дигидроиндазол-5-ил]метиленамино-4-метил-6-фенил- (5a), 2-[3-метил-1-(2-пиридил)-4-хлор-6,7-дигидроиндазол-5-ил]метиленамино-4-метил-6-фенил- (5b) и -6-(2-пиридил)- (5c) -7,8-дигидроиндазол[4,5-*d*]тиазолы. Сливают горячие растворы соответствующего амина **3** и 1-замещенного-3-метил-5-формил-4-хлор-6,7-дигидроиндазола [7] и кипятят 1 ч. Оставляют на 1 сут в холодильнике, отфильтровывают и перекристаллизовывают **5b,c** из ДМФА, **5a** – из смеси этанол–ДМФА.

2-[4-Метил-6-(2-пиридил)- (6a) и 2-[4-метил-6-фенил- (6b) -индазол[4,5-*d*]тиазол-2-ил]аминометил-1,3-индандионы, 2-[4-метил-6-(2-пиридил)индазол[4,5-*d*]тиазол-2-ил]аминометил-5,5-диметил-1,3-циклогександион (7). Сливают горячие растворы соответствующего амина **3** и 2-формил-1,3-циклогександиона, кипятят 10–15 мин. Охлаждают, отфильтровывают и перекристаллизовывают **6a,b** из ДМФА, **7c** – из смеси этанол–ДМФА.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. И. А. Стракова, А. Я. Страков, М. В. Петрова, *ХГС*, 497 (1996).
2. И. А. Стракова, А. Я. Страков, М. В. Петрова, *Latv. Ķīmijas Žurn.*, 733 (1994).
3. G. A. Nishiguchi, A. L. Rodriguez, J. A. Katzenellenbogen, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **12**, 947 (2002).
4. M. D. Chordia, L. J. Murphree, T. L. Macdonald, J. Linden, R. A. Olsson, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **12**, 1563 (2002).
5. R. Faure, A. Frideling, J.-P. Galy, J. Alkorta, J. Elguero, *Heterocycles*, **57**, 307 (2002).
6. V. Colotta, D. Catarzi, F. Varano, L. Cecchi, G. Filacchioni, C. Martini, L. Trincavelli, A. Lucacchini, *J. Med. Chem.*, **43**, 3118 (2000).
7. И. А. Стракова, Л. Г. Делятицкая, М. В. Петрова, А. Я. Страков, *ХГС*, 768 (1998).

*Рижский технический университет,
Рига LV-1048, Латвия
e-mail: marina@osi.lv*

Поступило в редакцию 08.10.2002