

# РЕАКЦИЯ 4-ГИДРОКСИ-1-МЕТИЛ-2,2-ДИОКСО-1*H*-2λ<sup>6</sup>,1-БЕНЗОТИАЗИН-3-КАРБОКСИЛАТА С 3-АМИНО-1,2,4-ТРИАЗОЛОМ

*И.В. Украинец, Л.А. Петрушова, С.П. Дзюбенко\**

*Национальный фармацевтический университет,*

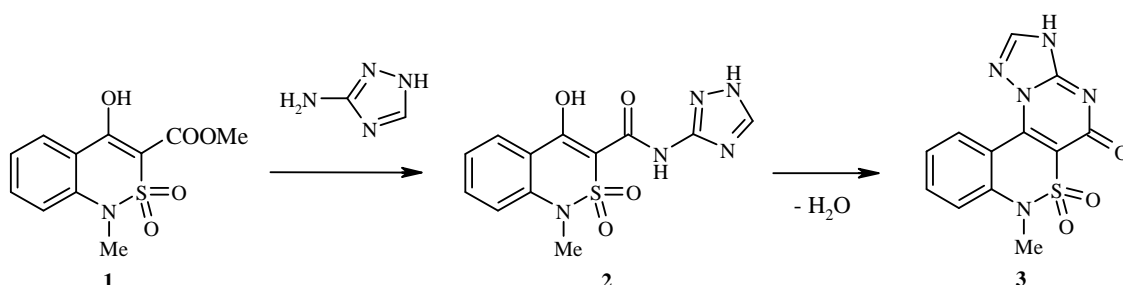
Украина, 61168, Харьков, ул. Блюхера, 4

*E-mail: uiv@kharkov.ua*

*\* Винницкий национальный медицинский университет им. Н.И. Пирогова*

Украина, 21018, Винница, ул. Пирогова, 56

Как известно, эфиры 1-*R*-4-гидрокси-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-3-карбоновых кислот легко амидируются первичными и вторичными алкил-, арил- и гетариламинами. Для сохранения высокой реакционной способности необходимо одновременное присутствие в пиридиновой части молекулы как 4-ОН, так и 2-С=О групп. С переходом к их 2-сульфоаналогам, т.е. к алкил-1-*R*-4-гидрокси-2,2-диоксо-1*H*-2λ<sup>6</sup>,1-бензотиазин-3-карбоксилатам мощное ацидифицирующее влияние сульфо-группы настолько сильно повышает 4-ОН-кислотность, что амидированию начинает препятствовать обычное солеобразование. Для сравнения отметим – соли алкил-1-*R*-4-гидрокси-2-оксо-1,2-дигидрохинолин-3-карбоксилатов с аминами крайне неустойчивы, быстро разлагаются даже углекислотой воздуха и, как правило, проблем при амидировании не создают. И наоборот, соли их 2-сульфоаналогов могут быть легко выделены и охарактеризованы. При нагревании в высококипящих инертных растворителях их всё же удаётся с хорошими выходами трансформировать в соответствующие 1-*R*-4-гидрокси-2,2-диоксо-1*H*-2λ<sup>6</sup>,1-бензотиазин-3-карбоксамиды. Правда, для этого требуется несколько часов, тогда как в случае 2-карбонильных производных аналогичная процедура занимает всего 3-5 минут. Кроме того, как оказалось, такие процессы не всегда останавливаются на стадии образования амида. Так, на примере реакции 4-гидрокси-1-метил-2,2-диоксо-1*H*-2λ<sup>6</sup>,1-бензотиазин-3-карбоксилата **1** с 3-амино-1,2,4-триазолом убедительно показано, что очевидно первоначально образующийся амид **2** в условиях синтеза сразу же подвергается более глубоким химическим превращениям, а именно внутримолекулярной циклодегидратации:



В результате с хорошим выходом получена новая гетероциклическая система – 7-метил-3*H*-[1,2,4]триазоло[5',1':2,3]пиримидо[5,4-*c*][2,1]бензотиазин-5(7*H*)-он 6,6-диоксид **3**, строение которого подтверждено спектрами ЯМР (<sup>1</sup>H и <sup>13</sup>C), масс-спектрометрически и рентгеноструктурным анализом.