

## РЕГИОСЕЛЕКТИВНОЕ АЛКИЛИРОВАНИЕ 5-R-ТЕТРАЗОЛОВ СПИРТАМИ В СРЕДЕ ЭФИРАТА ТРЕХФТОРИСТОГО БОРА И 1,2-ДИХЛОРЕТАНА

Егоров С. А.,<sup>a</sup> Ищенко М. А.<sup>a</sup>

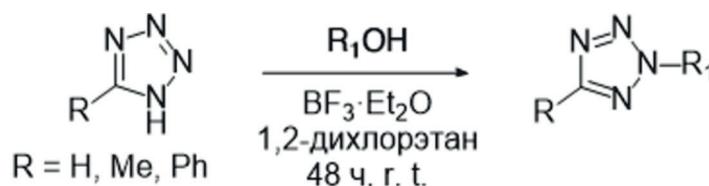
<sup>a</sup>Санкт-Петербургский Государственный Технологический институт (Технический университет),  
Московский пр. 26, Санкт-Петербург, 190013, Россия,  
e-mail: sergey.egorov93@mail.ru

Алкилирование 5-R-тетразолов является основным методом получения N-производных тетразолсодержащих соединений и единственным методом для получения 2-изомеров. Производные тетразола привлекают интерес в качестве лекарственных препаратов<sup>1</sup>. Высокое содержание азота и значительная энтальпия образования тетразольного цикла позволяют рассматривать тетразолы в качестве энергонасыщенных материалов.

Общей проблемой методов алкилирования тетразолов является нерегиоселективность данной реакции из-за возможности атаки, как первого, так и второго атома азота цикла, что приводит к нерациональному расходованию сырья и необходимости разделения смеси изомеров<sup>2</sup>.

Проблема решается методом кислото-катализируемого алкилирования тетразолов<sup>3</sup>. Он заключается в реакции 5-R-тетразола со спиртом или алкеном в среде сильной протонной кислоты. Метод обеспечивает региоселективность и высокие выходы получаемых продуктов, если спирты или алкены имеют структуру, обеспечивающую стабилизацию образующихся карбокатионов. Однако некоторые спирты разрушаются в сильных протонных кислотах, например, бензиловый спирт.

Нами найдена эффективная мягкая среда для алкилирования 5-R-тетразолов спиртами, имеющими подходящее строение для данной реакции ( $R_1$  = трет-Бу, Ад, Вп, кротил и другие спирты аллилового типа)<sup>4</sup>.



Установлено, что с использованием в качестве среды эфирата трехфтористого бора и 1,2-дихлорэтана (10 ÷ 15% масс.  $\text{BF}_3$ ) 2-изомеры 5-R-тетразолов получают региоселективно (>99%) и с выходами 50 – 80%.

### Литература

- 1 Островский В. А., Трифонов Р. Е., Попова Е. А. Изв. АН. Сер. хим. 2012, 765.
- 2 Колдобский Г. И., Островский В. А. Усп. хим. 1994, 63, 847.
- 3 Корень А. О., Гапоник П. Н. ХГС. 1990, 282, 1643
- 4 Егоров С. А., Ищенко М. А., Кирилов Н. А., Исхаков Р. С. ЖОХ. 2019, 55, 628