



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 163462

(13) U

(51) МПК

C07D 513/04 (2006.01)

A61K 31/496 (2006.01)

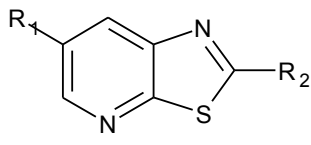
НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: u 2026 00474	(72) Винахідник(и): Толкунов Сергій Володимирович (UA), Толкунов Андрій Сергійович (UA), Смирнова Ольга Володимирівна (UA), Толкунов Валерій Сергійович (UA)
(22) Дата подання заявки: 28.01.2026	
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: 25.06.2026	
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: 24.06.2026, Бюл.№ 25	(73) Володілець (володільці): ІНСТИТУТ ФІЗИКО-ОРГАНІЧНОЇ ХІМІЇ І ВУГЛЕХІМІЇ ІМЕНІ Л.М. ЛИТВИНЕНКА НАЦІОНАЛЬНОЇ АКАДЕМІЇ НАУК УКРАЇНИ, шосе Харківське, 50, м. Київ, 02155 (UA)
	(74) Представник: Короткіх Ліна Михайлівна, реєстр. №43

(54) СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ПОХІДНИХ [1,3]ТІАЗОЛО[5,4-b]ПІРИДИНІВ**(57) Реферат:**

Спосіб одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-b]піридинів загальної формули:

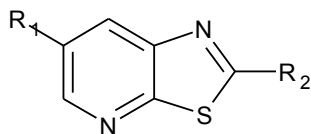


де R₁=H, Br, CF₃, COOCH₃, Cl, R₂=CH₃, CH₂Cl, C₆H₅, COOCH₃, CH₂COOCH₃, шляхом взаємодії похідних 3-амінопіридинів з хлорангідридами кислот в органічному розчиннику в присутності конденсуючого агента. Як похідні 3-амінопіридинів застосовують сполуки, вибрані з ряду: 5-бром-3-амінопіридин-2-тіол, 5-трифторметил-3-амінопіридин-2-тіол, 5-хлор-3-амінопіридин-2-тіол, метил 3-амінопіридин-2-тіол-5-карбоксилат, як органічний розчинник використовують хлороформ. Як конденсуючий агент - трифтороцтову кислоту, з подальшим виділенням цільових продуктів загальноприйнятими методами.

UA 163462 U

UA 163462 U

Корисна модель належить до органічної хімії, а саме до способу синтезу похідних [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів загальної формули:



5

де $R_1 = \text{H, Br, CF}_3, \text{COOCH}_3, \text{Cl}$, $R_2 = \text{CH}_3, \text{CH}_2\text{Cl, C}_6\text{H}_5, \text{COOCH}_3, \text{CH}_2\text{COOCH}_3$.

Серед похідних 1,3-тіазолопіридинів знайдені сполуки, що мають протизапальні властивості [1,2], протипухлинні [2-5], антиоксидантні [6], проявляють антимікробну активність [7-9]. На теперішній час існує підвищений інтерес до дизайну, синтезу та оцінки біологічної активності тіазоло[5,4-*b*]піридину [10].

10

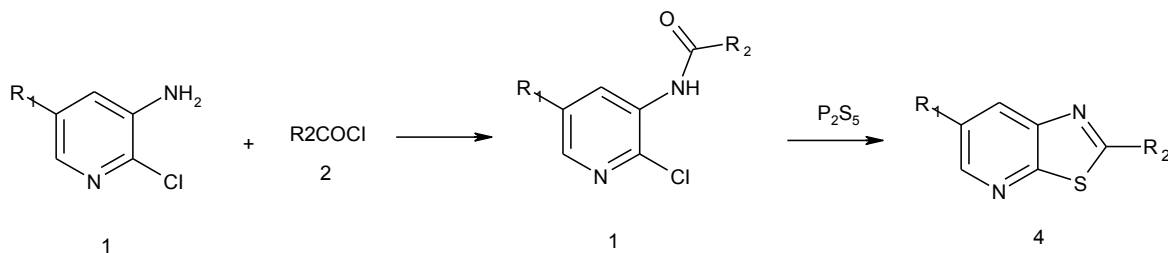
Наявність функціональних груп, таких як бром, карбоксильна група, в [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинах дає можливість для хімічного дизайну молекули шляхом її трансформації.

Сполуки такого типу можуть знайти застосування як біоактивні речовини, а також як ключові об'єкти для раціонального дизайну систем із вираженою фармакологічною дією.

15

Найближчим до способу, що заявляється, вибрано відомий спосіб (схема 1) одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів (4), який полягає у взаємодії 2-хлор-3-амінопіридинів (1) з хлорангідрідами кислот (2) з отриманням відповідних амідів (3) і подальшою циклізацією амідів (3) кип'ятінням з пентасульфідом фосфору в середовищі піридин-ксилолу впродовж 18 годин. Загальний період перебігу реакції триває 48 годин. Цей спосіб вибраний найближчим аналогом [11].

20



25

Схема 1

Недоліками відомого способу є:

1. Двостадійність процесу.
2. Завеликий час реакції - 48 годин (на дві стадії).

30

3. Використання великих кількостей токсичних реагентів: піридину, ксилолу для реакції, а також пентасульфиду фосфору.

4. Сумарний вихід цільових продуктів складає 41-80 %. Тобто багато з них одержують з низьким виходом.

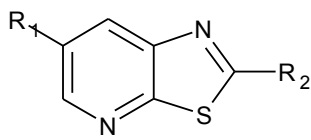
В основу корисної моделі поставлено задачу в способі одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів шляхом зміни технологічного процесу-одержання амідів та їх циклізацію - на пряму циклізацію 5- R_1 -3-амінопіридин-2-тіолів хлорангідрідами кислот у присутності каталізатора та конденсуючого агента - трифтороцтової кислоти, що дозволило синтезувати цільові продукти, а саме похідні 6- R_1 -2- R_2 -[1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів, в одну технологічну стадію з високими виходами, чистотою кінцевих продуктів і простим способом виділення. Запропонований спосіб є більш економічним, тому що проводиться в одну технологічну стадію впродовж 10 годин замість 48 годин за відомим способом і дозволяє синтезувати цільові продукти зі стабільним сумарним виходом 70-82 %.

35

40

Поставлена задача вирішується тим, що запропоновано спосіб одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів загальної формули:

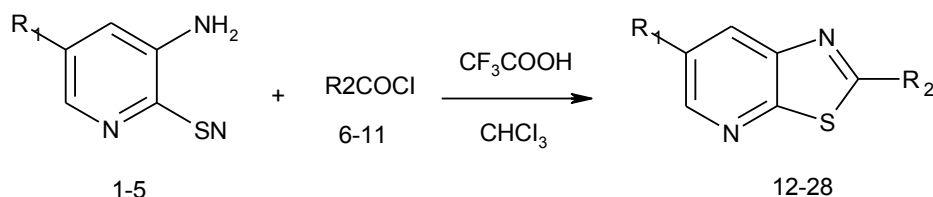
45



де $R_1 = \text{H, Br, CF}_3, \text{COOCH}_3, \text{Cl}$, $R_2 = \text{CH}_3, \text{CH}_2\text{Cl, C}_6\text{H}_5, \text{COOCH}_3, \text{CH}_2\text{COOCH}_3$,

5 шляхом взаємодії похідних 3-амінопіридинів з хлорангідрідами кислот в органічному розчиннику в присутності конденсуючого агента, згідно з корисною моделлю, як похідні 3-амінопіридинів застосовують сполуки, вибрані з ряду: 5-бром-3-амінопіридин-2-тіол, 5-трифторметил-3-амінопіридин-2-тіол, 5-хлор-3-амінопіридин-2-тіол, метил 3-амінопіридин-2-тіол-5-карбоксилат, як органічний розчинник використовують хлороформ, а як конденсуючий агент -
10 трифтороцтову кислоту, з подальшим виділенням цільових продуктів загальноприйнятими методами.

Спосіб одержання сполук, що заявляється, ілюструється схемою 2.



15

де 1 $R_1 = \text{H}$; 2 $R_1 = \text{Br}$; 3 $R_1 = \text{CF}_3$; 4 $R_1 = \text{COOCH}_3$; 5 $R_1 = \text{Cl}$; 6 $R_2 = \text{CH}_3$; 7 $R_2 = \text{CH}_2\text{Cl}$; 8 $R_2 = \text{Ph}$; 9 $R_2 = \text{COOCH}_3$; 10 $R_2 = \text{CH}_2\text{COOCH}_3$; 11 $R_2 = 3\text{-Br-Ph}$; 12 $R_1 = \text{H}$, $R_2 = \text{CH}_3$; 13 $R_1 = \text{H}$, $R_2 = \text{CH}_2\text{Cl}$; 14 $R_1 = \text{H}$, $R_2 = \text{Ph}$; 15 $R_1 = \text{H}$, $R_2 = \text{COOCH}_3$; 16 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{CH}_3$; 17 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{CH}_2\text{Cl}$; 18 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{Ph}$; 19 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{COOCH}_3$; 20 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = \text{CH}_2\text{COOCH}_3$; 21 $R_1 = \text{CF}_3$, $R_2 = \text{CH}_2\text{Cl}$; 22 $R_1 = \text{CF}_3$, $R_2 = \text{Ph}$; 23 $R_1 = \text{COOCH}_3$, $R_2 = \text{CH}_3$; 24 $R_1 = \text{COOCH}_3$, $R_2 = \text{Ph}$; 25 $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{CH}_2\text{Cl}$; 26 $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{Ph}$; 27 $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{COOCH}_3$; 28 $R_1 = \text{Br}$, $R_2 = 3\text{-Br-Ph}$.

Схема 2

25 Між сукупністю ознак корисної моделі і технічним результатом, якого досягають при її реалізації, існує причинно-наслідковий зв'язок.

Складові вихідні сполуки, реагенти та режими відомої технології не можуть забезпечити економічність, безпечність, екологічність, широкий асортимент одержаних продуктів. Недоліки відомої технології усуваються способом, що заявляється. 5- R_1 -3-Амінопіридин-2-тіоли (1-5) -
30 доступні сполуки, методи синтезу яких добре відпрацьовані [12]. Одержання широкого спектра похідних 2- R_2 -6- R_1 -[1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів за способом, що заявляється, відбулось завдяки корінній зміні технологічного процесу - одержання амідів та їх циклізацію замінили на пряму циклізацію 5- R_1 -3-амінопіридин-2-тіолів хлорангідрідами кислот у присутності каталізатора і одночасно конденсуючого агента і одночасно каталізатора - трифтороцтової кислоти, що дозволило синтезувати цільові продукти, а саме похідні 6- R_1 -6- R_2 -[1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів, в одну технологічну стадію зі стабільно високими виходами, чистотою кінцевих продуктів і простим способом виділення. Запропонований спосіб є більш економічним, тому що проводиться в одну технологічну стадію впродовж 10 годин і дозволяє синтезувати цільові
35 продукти з сумарним виходом 70-81 %.

40 Корисна модель ілюструється загальним методом одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-6]піридинів та фізико-хімічними характеристиками всіх синтезованих сполук. Вихідні похідні 5- R_1 -3-амінопіридин-2-тіолу (1-5) отримують за відомими методиками [12].

Загальна методика одержання похідних 6- R_1 -2- R_2 -[1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів (12-28). До суспензії 0,01 моль 5- R_1 -3-амінопіридин-2-тіолу (1-5) додають 0,015 моль відповідного хлорангідриду (6-11) і суміш кип'ятять впродовж 6 годин. Охолоджують до кімнатної температури та додають 3 мл трифтороцтової кислоти. Розчин кип'ятять 4 години. Розчинник видаляють у вакуумі і до залишку додають 5 % розчину карбонату натрію до pH 7,5-8,0. Осад відфільтровують, промивають водою, сушать.

Приклад 1. Спосіб одержання 2-метил-[1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридину (12). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-амінопіридин-2-тіол (1) та хлористий ацетил (6). Вихід 72 %. Т.т. 30-31 °C. ^1H ЯМР (400 МГц, DMSO- d_6) спектр, δ , ppm (J, Hz): 2,80 (3H, c, CH₃), 7,75

(1H, м, Н-6), 8,28 (1H, д, J=8,0, Н-7), 8,63 (1H, д, J=4,0, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 151 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 55,93; Н 4,06; N 18,61. C₇H₆N₂S. Обчислено, %: С 55,97; Н 4,03; N 18,65.

Приклад 2. Спосіб одержання 2-хлорметил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (13). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-амінопіридин-2-тіол (1) та хлорацетил хлорид (7).
5 Вихід 78 %. Т.т. 76-77 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,90 (2H, с, CH₂Cl), 7,73 (1H, м, Н-6), 8,30 (1H, д, J=8,0, Н-7), 8,60 (1H, д, J=4,0, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 184 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 45,50; Н 2,70; N 15,19. C₇H₅ClN₂S. Обчислено, %: С 45,53; Н 2,73; N 15,17.

Приклад 3. Спосіб одержання 2-феніл[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (14). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-амінопіридин-2-тіол (1) та бензоїл хлорид (8). Вихід 77 %. Т.т. 121-122 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) спектр, δ, ppm (J, Hz): 7,50-7,57 (3H, м, Н-3',4',5'), 7,78 (1H, м, Н-6), 8,08 (2H, д, J=8,4 Н-2',6'), 8,70 (1H, д, J=8,0, Н-7), 8,85 (1H, д, J=4,0, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 213 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 67,95; Н 3,82; N 13,18. C₁₂H₈N₂S. Обчислено, %: С 67,90; Н 3,80; N 13,20.

Приклад 4. Спосіб одержання метил [1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-2-карбокси-лату (15). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-амінопіридин-2-тіол (1) та метил 2-хлор-2-оксоацетат (9). Вихід 75 %. Т.т. 152-153 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) спектр, δ, ppm (J, Hz): 3,99 (3H, с, COOCH₃), 7,75 (1H, м, Н-6), 8,68 (1H, д, J=8,0, Н-7), 8,83 (1H, д, J=4,0, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 195 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: 49,43; Н 3,14; N 14,40. C₈H₆N₂O₂S. Обчислено, %: С 49,47; Н 3,11; N 14,42.

Приклад 5. Спосіб одержання 6-бром-2-метил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (16). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та хлористий ацетил (6). Вихід 73 %. Т.т. 112-113 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) спектр, δ, ppm (J, Hz): 2,84 (3H, с, 2-CH₃), 8,66 (1H, д, J=2,0, Н-5), 8,58 (1H, д, J=2,0, Н-7). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 231 [M(⁸¹Br)+H]⁺ (74), 229 [M(⁷⁹Br)+H]⁺ (70). Знайдено, %: С 36,74; Н 2,22; N 12,20. C₇H₅BrN₂S. Обчислено, %: С 36,70; Н 2,20; N 12,23.

Приклад 6. Спосіб одержання 6-бром-2-хлорметил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (17). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та хлорацетил хлорид (7). Вихід 81 %. Т.т. 78-79 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,90 (2H, с, CH₂Cl), 8,37 (1H, д, J=2,0 Hz Н-7), 8,64 (1H, д, J=2,0 Hz Н-7). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 263 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 31,94; Н 1,50; N 10,67. C₇H₄BrClN₂S. Обчислено, %: С 31,90; Н 1,53; N 10,63.

Приклад 7. Спосіб одержання 6-бром-2-феніл[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (18). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та бензоїл хлорид (8). Вихід 82 %. Т.т. 171-172 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 7,51-7,57 (3H, м, Н-3',4',5'), 8,09 (2H, д, J=8,0 Н-2',6'), 8,42 (1H, д, J=2,0, Н-7), 8,62 (1H, д, J=2,0, Н-5). ¹³C NMR spectrum (125,7 МГц, CDCl₃), δ, ppm: 170,44, 156,57, 148,21, 147,74, 133,05, 132,25, 131,92, 129,15 (2C), 127,66 (2C), 118,02. Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 291 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 49,54; Н 2,45; N 9,60. Cl₂H₇BrN₂S. Обчислено, %: 49,50; Н 2,42; N 9,62.

Приклад 8. Спосіб одержання метил 6-бром-[1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-2-карбоксилату (19). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та метил 2-хлор-2-оксоацетат (9). Вихід 79 %. Т.т. 211-212 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,09 (3H, с, COOCH₃), 8,58 (1H, д, J=2,0, Н-7), 8,77 (1H, д, J=2,0, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 273 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 35,14; Н 1,86; N 10,27. C₈H₅BrN₂O₂S. Обчислено, %: С 35,18; Н 1,85; N 10,26.

Приклад 9. Спосіб одержання метил (6-бром-[1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-2-іл)-ацетату (20). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та метил 3-хлор-2-оксопропанат (10). Вихід 70 %. Т.т. 97-98 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 3,81 (3H, с, COOCH₃), 4,19 (2H, с, CH₂), 8,37 (1H, с, Н-7), 8,64 (1H, с, Н-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 287 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 37,68; Н 2,43; N 9,74. C₉H₇BrN₂O₂S. Обчислено, %: С 37,65; Н 2,46; N 9,76.

Приклад 10. Спосіб одержання 6-трифторметил-2-хлорметил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (21). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-трифторметилпіридин-2-тіол (3) та хлорацетил хлорид (7). Вихід 77 %. Т.т. 59-60 °С. ¹H NMR (400 МГц, CDCl₃): 4,95 (2H, с, CH₂Cl), 8,50 (1H, с, Н-5), 8,92 (1H, с, Н-7). ¹⁹F NMR (376 МГц, CDCl₃): -61,76. Мас-спектр, m/z (I_{rel}, %): 251 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: С 42,91; Н 2,05; N 5,55. C₉H₅ClF₃NS. Обчислено, %: С 42,95; Н 2,00; N 5,57.

Приклад 11. Спосіб одержання 6-трифторметил-2-феніл[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (22). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-трифторметилпіридин-2-тіол (3) та бензоїл хлорид (8). Вихід 72 %. Т.т. 136-137 °С. ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J,

Hz): 7,41-7,62 (H-3',4',5'), 8,09 (2H, д, J=8,0 H-2',6'), 8,49 (1H, с, H-5), 8,82 (1H, с, H-7). ¹⁹F NMR (376 MHz, CDCl₃): -61,71. Мас-спектр, m/z (I_{rel}, %): 281 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 55,74; H 2,55; N 10,05. C₁₃H₇F₃N₂S. Обчислено, %: C 55,71; H 2,52; N 10,00. Приклад 12. Спосіб одержання метил 2-метил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-6-карбоксилату (23). Отримують за загальною методикою, використовуючи метил 3-амінопіридин-2-тіол-5-карбоксилат (4) та хлористий ацетил (6). Вихід 74 %. Т.т. 132-133 °C. ¹H ЯМР (400 MHz, DMSO-d₆) спектр, δ, ppm (J, Hz): 2,86 (3H, с, CH₃), 3,92 (3H, с, COOCH₃), 8,60 (1H, с, H-7), 9,00 (1H, с, H-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 209 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 51,95; H 3,84; N 13,47. C₉H₈N₂O₂S. Обчислено, %: C 51,91; H 3,87; N 13,45.

Приклад 13. Спосіб одержання метил 2-феніл[1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-6-карбоксилату (24). Отримують за загальною методикою, використовуючи метил 3-амінопіридин-2-тіол-5-карбоксилат (4) та бензоїл хлорид (8). Вихід 80 %. Т.т. 166-167 °C. ¹H ЯМР (500 MHz, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,01 (3H, с, COOCH₃), 7,52 (3H, м, H-3',4',5'), 8,10 (2H, д, J=7,0 H-2',6'), 8,83 (1H, д, J=1,5, H-7), 9,16 (1H, д, J=1,5, H-5). Мас-спектр, m/z (W%): 271 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 62,27; H 3,70; N 10,33. C₁₄H₁₀N₂O₂S. Обчислено, %: C 62,21; H 3,73; N 10,36.

Приклад 14. Спосіб одержання 6-хлор-2-хлорметил[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (25). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-хлорпіридин-2-тіол (5) та хлорацетил хлорид (7). Вихід 78 %. Т.т. 96-97 °C. ¹H ЯМР (400 MHz, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,92 (2H, с, CH₂Cl), 8,38 (1H, д, J=2,0 Hz H-7), 8,62 (1H, д, J=2,0 Hz H-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 218 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 38,40; H 1,81; N 12,75. C₇H₄Cl₂N₂S. Обчислено, %: C 38,37; H 1,84; N 12,79.

Приклад 15. Спосіб одержання 6-хлор-2-феніл[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (26). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-хлорпіридин-2-тіол (5) та бензоїл хлорид (8). Вихід 79 %. Т.т. 168-169 °C. ¹H ЯМР (400 MHz, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 7,51-7,57 (3H, м, H-3',4',5'), 8,09 (2H, д, J=8,0 H-2',6'), 8,42 (1H, д, J=2,0, H-7), 8,62 (1H, с, J=2,0, H-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 246 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 58,46; H 2,84; N 11,32. C₂H₇ClN₂S. Обчислено, %: C 58,42; H 2,86; N 11,35.

Приклад 16. Спосіб одержання метил 6-хлор[1,3]тіазоло[5,4-b]піридин-2-карбоксилату (27). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-хлорпіридин-2-тіол (5) та метил 2-хлор-2-оксоацетат (9). Вихід 70 %. Т.т. 186-187 °C. ¹H ЯМР (400 MHz, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 4,10 (3H, с, COOCH₃), 8,60 (1H, д, J=2,0, H-7), 8,79 (1H, д, J=2,0, H-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 228 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 42,07; H 2,17; N 12,21. C₈H₅ClN₂O₂S. Обчислено, %: C 42,02; H 2,20; N 12,25.

Приклад 17. Спосіб одержання 6-бром-2-(3-бромфеніл)[1,3]тіазоло[5,4-b]піридину (28). Отримують за загальною методикою, використовуючи 3-аміно-5-бромпіридин-2-тіол (2) та 3-бромбензоїл хлорид (11). Вихід 80 %. Т.т. 180-181 °C. ¹H ЯМР (400 MHz, CDCl₃) спектр, δ, ppm (J, Hz): 7,39 (1H, с, Наром), 7,67 (1H, с, Наром), 7,97 (1H, с, Наром), 8,24 (1H, с, Наром), 8,41 (1H, с, H-7), 8,63 (1H, с, H-5). Мас-спектр, m/z (I_{відн}, %): 370 [M+H]⁺ (100). Знайдено, %: C 38,98; H 1,59; N 7,64. C₁₂H₆Br₂N₂S. Обчислено, %: C 38,95; H 1,63; N 7,57.

Джерела інформації:

1. Anti-inflammatory properties of some novel thiazolo[4,5-b]pyridin-2-ones / T. I. Chaban, et.al. // Pharmacia, 2020. - Vol. 67, № 3. - P. 121-127.

2. Discovery of AMG 369, a Thiazolo[5,4-b]pyridine Agonist of S1P1 and S1P5 / V.J. Cee, et.al. // ACS Med. Chem. Lett. 2011. - № 2. - P. 107-112.

3. Abdallah A.E.M., Mohareb R.M., Ahmed E.A. Novel Pyrano[2,3-d]thiazole and Thiazolo[4,5-b]pyridine Derivatives: One-pot Three-component Synthesis and Biological Evaluation as Anticancer Agents, c-Met, and Pim-1 Kinase Inhibitors // J. Heterocycl. Chem. 2019. - P. 1-13.

4. Synthesis and Antitumor Evaluation of New Thiazolo[5,4-b]quinoline Derivatives / C Alvarez-Ibarra, et.al. // J. Med. Chem. 1997. - Vol. 40. - P. 668-676.

5. Identification of Novel Thiazolo[5,4-b]Pyridine Derivatives as Potent Phospho-inositide 3-Kinase Inhibitors / L. Xia, et.al. // Molecules. 2020. - Vol. 25. - P. 4630-40.

6. Синтез та антиоксидантні властивості нових тіазоло[4,5-b]піридин-2-онів / Т. І. Чабан, та інші // Ж. Орг. фарм. хім. 2019. - Vol. 17, № 3. - P. 15-19.

7. TXA709, an FtsZ-Targeting Benzamide Prodrug with Improved Pharmacokinetics and Enhanced In Vivo Efficacy against Methicillin-Resistant Staphylococcus aureus IM. Kaul, et. al. // Antimicrob. Agent. & Chemotherap. 2015. - Vol. 59, № 8. - P. 4845-4855.

8. Синтез та вивчення антимікробної активності деяких тіазоло[4,5-b]піридинів / Т. І. Чабан, та інші. // Ж. Орг. фарм. хім. 2012. ТЛЮ, вип. 2 (38). - P. 70-76.

9. Antimicrobial and cytotoxic activities of thiazolo[4,5-b]pyridine Derivatives / A. V. Lozynskyi et. al. // Biopolymers and Cell. 2021. - Vol. 37, № 2. - P. 153-164.

10. Creating an Antibacterial with in Vivo Efficacy: Synthesis and Characterization of Potent Inhibitors of the Bacterial Cell Division Protein FtsZ with Improved Pharmaceutical Properties / D. J. Haydon et. al, // J. Med. Chem. 2010. - Vol. 53. - P. 3927-3936.

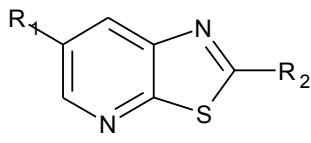
11. Thiazolopyridine sirtuin modulating compounds: WO2010/071853 Al: C07D 513/04, A61P 3/00, A61P 25/00, A61K 31/437, A61P 5/50, A61P 31/00, A61K 31/496, A61P 9/00, A61P 37/00, A61K 31/5377, A61P19/00 / Oalman C, Disch J.S., Perni R.B. - Appl. N° PCT/ US2009/068865, Dec 19, 2009.

12. Safonova T.S., Levkovskaya L.G. Research on nitrogen and sulfur-containing heterocycles. Chem Heterocycl Compd. 1968. - № 4. - P. 720-723.

10

ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

Спосіб одержання похідних [1,3]тіазоло[5,4-*b*]піридинів загальної формули:



15

де R₁=H, Br, CF₃, COOCH₃, Cl, R₂=CH₃, CH₂Cl, C₆H₅, COOCH₃, CH₂COOCH₃, шляхом взаємодії похідних 3-амінопіридинів з хлорангідрідами кислот в органічному розчиннику в присутності конденсуючого агента, який **відрізняється** тим, що як похідні 3-амінопіридинів застосовують сполуки, вибрані з ряду: 5-бром-3-амінопіридин-2-тіол, 5-трифторметил-3-амінопіридин-2-тіол, 5-хлор-3-амінопіридин-2-тіол, метил 3-амінопіридин-2-тіол-5-карбоксилат, як органічний розчинник використовують хлороформ, а як конденсуючий агент - трифтороцтову кислоту, з подальшим виділенням цільових продуктів загальноприйнятими методами.

20