

УДК 547.725.814.2224:541.124

СИНТЕЗ И ОТНОСИТЕЛЬНАЯ РЕАКЦИОННАЯ СПОСОБНОСТЬ 2-(ТИОФЕН-2-ИЛ)[1,3]ТИАЗОЛО[4,5-*f*]ХИНОЛИНА

© 2020 г. А. А. Александров*, Д. А. Заблоцкий, М. М. Ельчанинов

ФГБОУ ВО «Южно-Российский государственный политехнический университет (НПИ) им. М.И.Платова», 346428, Россия, г. Новочеркасск, ул. Просвещения 132

*e-mail: aaanet1@yandex.ru

Поступила в редакцию 21 июня 2019 г.

После доработки 12 ноября 2019 г.

Принята к публикации 22 ноября 2019 г.

Конденсацией хинолин-5-амина с тиофен-2-карбонилхлоридом в 2-пропанол синтезирован *N*-(хинолин-5-ил)тиофен-2-карбоксамид. Обработкой которого, избытком P₂S₅ в безводном пиридине получен соответствующий тиоамид. Окислением последнего феррицианидом калия в щелочной среде синтезирован 2-(тиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолин. Далее продукт аннелирования был введен в реакции электрофильного замещения: нитрование, сульфирование, бромирование, формилирование, ацилирование. Заместитель вступает исключительно в положение 5 тиофенового ядра. При ацетилировании наблюдается образование двух производных: метилкетона и дикетона с прохиральной метиленовой группой.

Ключевые слова: хинолин-5-амин, *N*-(хинолин-5-ил)тиофен-2-карбоксамид, *N*-(хинолин-5-ил)тиофен-2-карботиоамид, окисление, феррицианид калия, реакции электрофильного замещения.

DOI: 10.31857/S0514749220010103

Известно какую важную роль в современной теоретической и прикладной химии играют бисгетероарены. На их основе синтезируются эффективные фармацевтические препараты [1], гербициды [1] и люминофоры [2]. Введение в гетарилбензазолы аннелированных заместителей, увеличивающих сопряженную π-систему, способствует повышению квантового выхода. Ранее нами были изучены электронное строение и спектральные свойства конденсированных 2-гетарилимидазолов [3].

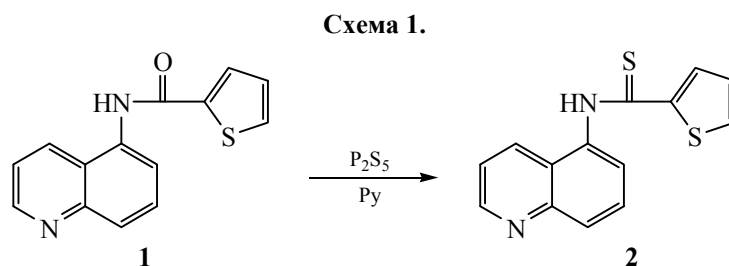
В свете сказанного наше внимание привлек ранее не изученный тиазоло[4,5-*f*]хинолин, связанный простой связью с тиофеновым кольцом. Учитывая выдающиеся фармакофорные свойства тиазола и тиофена, можно ожидать проявления этим соединением и его производными разнообразной биологической активности. Кроме того, взаимное влияние тиазолохинолинового фрагмента и тиофенового ядра должно интересным образом отразиться на реакционной способности.

В связи с чем мы задались целью разработать или подобрать удобный способ аннелирования 2-(тиофен-2-ил)тиазольного фрагмента к хинолину.

Для этого мы попытались применить метод получения бензотиазолов по Якобсону [4, 5], заключающийся в циклизации тиоамидов бензола в водных растворах щелочей в присутствии феррицианида калия.

Исходный *N*-(хинолин-5-ил)тиофен-2-карбоксамид (**1**) получен нами с выходом 77% при кипячении в 2-пропанол хинолин-5-амина с тиофен-2-карбонилхлоридом. Нагревание соединения **1** с избытком пентасернистого фосфора в сухом пиридине позволяет обменять кислород карбонильной группы на серу с выходом соединения **2** ~ 67% (схема 1).

Затем *N*-(хинолин-5-ил)тиофен-2-карботиоамид **2** растворяли в водном 2-пропанол подщелачивали 2%-ным раствором КОН и окисляли реакционную массу 20%-ным водным раствором K₃[Fe(CN)₆]. В результате с выходом 29% выделили кристаллы белого цвета. В спектре ЯМР ¹H этого вещества сигналы 4 и 5 протонов хинолинового кольца зафиксированы форме дублетов при δ 8.23 и 8.28 м.д. с характерными КССВ 9.0 Гц, что говорит об 5,6-аннелировании 2-(тиофен-2-ил)тиазольного фраг-



мента к хинолину. Калия феррицианид в щелочном растворе действует как комплексный ион, отщепляющий электрон и в результате такого окисления карботиоамида **2** образуется катион-радикал, который элиминируя протон превращается в S-радикал после чего следует замыкание тиазольного кольца.

Далее синтезированный 2-(тиофен-2-ил)[1,3]-тиазоло[4,5-*f*]хинолин (**3**) с целью изучения его относительной реакционной способности был подвергнут действию электрофильных реагентов: азотной кислоты, брома в дихлорэтано, смеси серной и полифосфорной кислот, уротропина в (ПФК), уксусного ангидрида и бензойной кислоты в ПФК (схема 2).

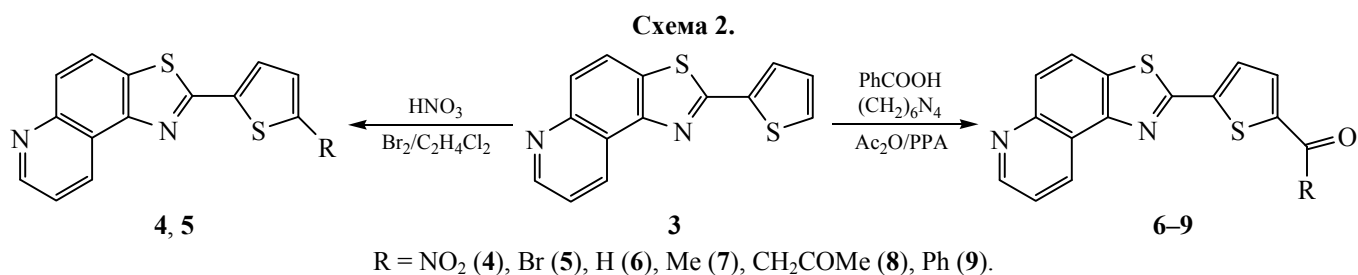
Взаимодействие соединения **3** с кипящей разбавленной азотной кислотой ($d\ 1.32\ \text{г/см}^3$) не приводит к образованию нитропроизводного, в основном регенерируется исходное вещество. Ввиду сильной дезактивации тиофенового ядра дважды протонированным тиазолохинолиновым фрагментом 5-нитропродукт **4** по пятичленному гетероциклу удалось получить при нитровании дымящей азотной кислотой ($d\ 1.51\ \text{г/см}^3$) в ПФК при 95°C с выходом 41%. Бромирование соединения **3** избытком брома в дихлорэтано заканчивается также образованием 5-бромпроизводного **5** по тиофеновому кольцу.

Нам не удалось, как и в случае имидазохинолинового аналога [6] зафиксировать продукт сульфирования соединения **3** действием смеси серной и полифосфорной кислот. В разных условиях проведения реакции регенерируется исходное вещество.

2-(Тиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолин (**3**), как и изученный ранее имидазохинолин, не формилируется по Вильсмайеру [7] даже при повышенной температуре ($80\text{--}90^\circ\text{C}$). Однако его нагревание с уротропином в среде ПФК при $90\text{--}100^\circ\text{C}$ дает в качестве единственного продукта реакции соответствующее 5-формилпроизводное **6** с выходом 64%.

Ацетилирование соединения **3**, учитывая дезактивирующее влияние тиазолохинолинового фрагмента на реакционную способность тиофенового кольца, удалось осуществить лишь действием уксусного ангидрида в среде ПФК при $130\text{--}140^\circ\text{C}$. Реакция протекает неселективно и сопровождается образованием побочного продукта, количество которого увеличивается с ростом температуры, в связи с чем метилкетон **7** был получен с выходом не превышающим 42%. Выделенный с помощью колоночной хроматографии побочный продукт, согласно спектру ЯМР ^1H оказался дикетоном **8**, образующимся в результате ацетилирования группы COCH_3 в монокетоне **7**. Прохиральность протонов метиленовой группы (H_α и H_β) в ацетоацетильном заместителе соединения **8** приводит к диастереотопному расщеплению их сигналов в виде двух дублетов при 6.28 и 6.82 м.д. В ИК спектре соединения **8** наблюдаются интенсивные двойные полосы колебаний карбонильных групп ацетоацетильного фрагмента в области $1645\text{--}1678\ \text{см}^{-1}$, подтверждающие структуру данного соединения.

Бензоилирование 2-(тиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолина (**3**) проводили действием бензойной



кислоты в ПФК, но при более высокой температуре (150–160°C). Как и при ацетилировании образуется 5-бензоилкетон **9** по пятичленному гетероциклу с выходом 61%.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

ИК спектры регистрировали на спектрометре Specord 75IR в вазелиновом масле, спектры ^1H ЯМР записаны на приборе Varian Unity 300 (300 МГц, ДМСО- d_6 , внутренний стандарт – ТМС). Ход реакции контролировали при помощи ТСХ на пластинках с Al_2O_3 . II степени активности по Брокману, проявление парами иода (элюент – CH_2Cl_2 , CHCl_3). Элементный анализ проводили на анализаторе Perkin Elmer 2400. Температуры плавления определяли капиллярным методом на приборе ПТП.

N-(Хинолин-5-ил)тиофен-2-карбоксамид (1). Растворяли 8.65 г (0.06 моль) хинолин-5-амина в 60 мл 2-пропанола после чего к полученному раствору прибавляли 8.80 г (0.06 моль) тиофен-2-карбонилхлорида. Смесь нагревали до кипения в течение 2 ч, затем выливали в 50 мл воды, нейтрализовали до слабощелочной реакции раствором аммиака и ставили в холодильник на 24 ч. Выделившийся осадок соединения **1** отфильтровывали и кристаллизовали из 2-пропанола. Выход 11.75 г (77%) бесцветных кристаллов с т.пл. 223–224°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3263 ш (NH), 1683 с (C=O). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.23 т (1H, $\text{H}^4_{\text{тиофен}}$, J 3.9 Гц), 7.51 д.д (1H, $\text{H}^3_{\text{хинолин}}$, J 4.2 Гц), 7.63 т (1H, $\text{H}^7_{\text{хинолин}}$, J 7.8 Гц), 7.68 д (1H, $\text{H}^6_{\text{хинолин}}$, J 7.6 Гц), 7.84 д (1H, $\text{H}^3_{\text{тиофен}}$, J 3.6 Гц), 7.96 д (1H, $\text{H}^8_{\text{хинолин}}$, J 7.5 Гц), 8.03 д (1H, $\text{H}^5_{\text{тиофен}}$, J 5.1 Гц), 8.32 д (1H, $\text{H}^4_{\text{хинолин}}$, J 8.1 Гц), 8.79 д (1H, $\text{H}^2_{\text{хинолин}}$, J 2.7 Гц), 10.47 с (1H, NH). Найдено, %: С 65.89; Н 4.17; N 10.79. $\text{C}_{14}\text{H}_{10}\text{N}_2\text{OS}$. Вычислено, %: С 66.12; Н 3.96; N 11.02.

N-(Хинолин-5-ил)тиофен-2-карботиоамид (2). К раствору 11.44 г (0.045 моль) соединения **1** в 50 мл безводного пиридина прибавляли 5.55 г (0.025 моль) пентасернистого фосфора. Смесь нагревали до кипения 3 ч, затем охлаждали и выливали в 100 мл воды. Выпавший желтый осадок соединения **2** отделяли и кристаллизовали из водного 2-пропанола. Выход 8.15 г (67%) желтых кристаллов с т.пл. 102–103°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 3353 ш (NH), 1236 с (C=S). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.25 т (1H, $\text{H}^4_{\text{тиофен}}$, J 3.9 Гц), 7.55 д.д (1H, $\text{H}^3_{\text{хинолин}}$, J 4.2 Гц), 7.64 т (1H, $\text{H}^7_{\text{хинолин}}$, J 7.8 Гц), 7.70 д (1H, $\text{H}^6_{\text{хинолин}}$, J 7.6 Гц), 7.83 д (1H, $\text{H}^3_{\text{тиофен}}$, J 3.6 Гц), 7.95 д (1H, $\text{H}^8_{\text{хинолин}}$, J 7.5 Гц), 8.05 д (1H, $\text{H}^5_{\text{тиофен}}$, J 5.1 Гц), 8.33 д

(1H, $\text{H}^4_{\text{хинолин}}$, J 8.1 Гц), 8.81 д (1H, $\text{H}^2_{\text{хинолин}}$, J 2.7 Гц), 11.33 с (1H, NH). Найдено, %: С 62.37; Н 3.59; N 10.47. $\text{C}_{14}\text{H}_{10}\text{N}_2\text{S}_2$. Вычислено, %: С 62.19; Н 3.73; N 10.36.

2-(Тиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолин (3). Растворяли в 20 мл 2-пропанола 8.11 г (0.03 моль) соединения **2** после чего добавляли 15 мл 1%-ного гидроксида калия, в полученную массу постепенно приливали 50 мл теплого водного раствора $\text{K}_3[\text{Fe}(\text{CN})_6]$, содержащего 29.61 г (0.09 моль) соли. Смесь тщательно перемешивали и оставляли стоять при комнатной температуре на ночь, выпавший осадок вещества **3** отделяли и кристаллизовали из водного этанола. Получены бесцветные кристаллы с т.пл. 176–177°C. Выход 2.33 г (29%). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.28 т (1H, $\text{H}^4_{\text{тиофен}}$, J 3.9 Гц), 7.71 д.д (1H, $\text{H}^8_{\text{хинолин}}$, J 4.3 Гц), 7.82 д (1H, $\text{H}^3_{\text{тиофен}}$, J 3.6 Гц), 8.07 д (1H, $\text{H}^5_{\text{тиофен}}$, J 4.9 Гц), 8.23 д (1H, $\text{H}^4_{\text{хинолин}}$, J 9.0 Гц), 8.28 д (1H, $\text{H}^5_{\text{хинолин}}$, J 9.0 Гц), 8.79 д (1H, $\text{H}^9_{\text{хинолин}}$, J 8.1 Гц), 8.95 д (1H, $\text{H}^7_{\text{хинолин}}$, J 3.1 Гц). Найдено, %: С 62.41; Н 2.87; N 10.56. $\text{C}_{14}\text{H}_8\text{N}_2\text{S}_2$. Вычислено, %: С 62.66; Н 3.00; N 10.44.

2-(5-Нитротиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолин (4). Смесь 0.268 г (1 ммоль) соединения **3** и 0.2 мл азотной кислоты (d 1.42 г/см 3) в 5 г ПФК перемешивали при температуре 95°C 3 ч. Затем реакционную массу выливали в 100 мл холодной воды, нейтрализовали до слабощелочной реакции раствором аммиака, выпавший осадок отделяли и промывали 2–3 раза небольшим количеством холодной воды. Выход 0.13 г (41%) желтых кристаллов из 2-пропанола с т.пл. 248–249°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1543 ($\nu_{\text{as}}\text{NO}_2$), 1385 ($\nu_{\text{s}}\text{NO}_2$). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.73 д (1H, $\text{H}^8_{\text{хинолин}}$, J 4.6 Гц), 8.01 д (1H, $\text{H}^3_{\text{тиофен}}$, J 4.3 Гц), 8.25 д (1H, $\text{H}^4_{\text{хинолин}}$, J 9.0 Гц), 8.31 д (1H, $\text{H}^5_{\text{хинолин}}$, J 9.1 Гц), 8.45 д (1H, $\text{H}^4_{\text{тиофен}}$, J 4.3 Гц), 8.81 д (1H, $\text{H}^9_{\text{хинолин}}$, J 8.0 Гц), 8.95 д (1H, $\text{H}^7_{\text{хинолин}}$, J 4.0 Гц). Найдено, %: С 53.78; Н 2.39; N 13.23. $\text{C}_{14}\text{H}_7\text{N}_3\text{O}_2\text{S}_2$. Вычислено, %: С 53.66; Н 2.25; N 13.41.

2-(5-Бромтиофен-2-ил)[1,3]тиазоло[4,5-*f*]хинолин (5). К раствору 0.268 г (1 ммоль) соединения **3** в 10 мл дихлорэтана прибавляли 0.48 г (3 ммоль) брома. Смесь кипятили 4 ч, затем испаряли дихлорэтан, а остаток нейтрализовали раствором аммиака. Бежевые кристаллы отделяли и кристаллизовали из водного 2-пропанола. Выход 0.22 г (64%), т.пл. 193–194°C. Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.18 д (1H, $\text{H}^4_{\text{тиофен}}$, J 4.5 Гц), 7.73 д (1H, $\text{H}^8_{\text{хинолин}}$, J 4.6 Гц), 7.79 д (1H, $\text{H}^3_{\text{тиофен}}$, J 4.5 Гц), 8.25 д (1H, $\text{H}^4_{\text{хинолин}}$, J 9.0 Гц), 8.31 д (1H, $\text{H}^5_{\text{хинолин}}$, J 9.1 Гц), 8.81 д (1H, $\text{H}^9_{\text{хинолин}}$,

J 8.0 Гц), 8.95 д (1H, $H_{\text{хин}}^7$, J 4.0 Гц). Найдено, %: C 48.19; H 1.95; N 7.83. $C_{14}H_7BrN_2S_2$. Вычислено, %: C 48.42; H 2.03; N 8.07.

5-([1,3]Тиазоло[4,5- f]хинолин-2-ил)тиофен-2-карбальдегид (6). Перемешивали 0.268 г (1 ммоль) соединения **3** и 0.42 г (3 ммоль) уротропина в 5 г полифосфорной кислоты при 110–120°C 5 ч. Затем реакцию массу разбавляли 10 мл воды и осторожно нейтрализовали раствором аммиака. Выделившийся продукт реакции экстрагировали 15 мл хлороформа и хроматографировали на колонке (h 10 см, d 2,5 см) с оксидом алюминия, элюируя хлороформом. Соединение **6** кристаллизовали из этанола. Выход 0.20 г (64%) желтых кристаллов, т.пл. 192–193°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1665 с (C=O). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.73 д.д (1H, $H_{\text{хин}}^8$, J 4.5 Гц), 7.92 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^3$, J 3.9 Гц), 7.98 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^4$, J 3.9 Гц), 8.25 д (1H, $H_{\text{хин}}^4$, J 8.9 Гц), 8.32 д (1H, $H_{\text{хин}}^5$, J 9.0 Гц), 8.74 д (1H, $H_{\text{хин}}^9$, J 8.1 Гц), 8.96 д (1H, $H_{\text{хин}}^7$, J 3.2 Гц). 9.82 с (1H, СНО). Найдено, %: C 60.94; H 2.49; N 9.57. $C_{15}H_8N_2OS_2$. Вычислено, %: C 60.79; H 2.72; N 9.45.

1-[5-([1,3]Тиазоло[4,5- f]хинолин-2-ил)тиофен-2-ил]этан-1-он (7). Смесь 0.268 г (1 ммоль) соединения **3** и 0.31 г (3 ммоль) уксусного ангидрида в 5 г полифосфорной кислоты перемешивали при 110–120°C в течение 15 ч. Затем реакцию массу разбавляли 10 мл воды и нейтрализовали раствором аммиака. Далее выделение продукта реакции проводили аналогично соединению **6**. Соединение **7** кристаллизовали из метанола. Выход 0.13 г (42%) бесцветных кристаллов, т.пл. 170–171°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1671 с (C=O). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 2.85 с (3H, CH_3), 7.75 д.д (1H, $H_{\text{хин}}^8$, J 4.5 Гц), 7.96 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^3$, J 4.0 Гц), 7.99 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^4$, J 4.0 Гц), 8.23 д (1H, $H_{\text{хин}}^4$, J 8.9 Гц), 8.34 д (1H, $H_{\text{хин}}^5$, J 9.0 Гц), 8.77 д (1H, $H_{\text{хин}}^9$, J 8.1 Гц), 8.95 д (1H, $H_{\text{хин}}^7$, J 3.2 Гц). Найдено, %: C 62.15; H 3.41; N 8.84. $C_{16}H_{10}N_2OS_2$. Вычислено, %: C 61.91; H 3.25; N 9.02.

1-[5-([1,3]Тиазоло[4,5- f]хинолин-2-ил)тиофен-2-ил]бутан-1,3-дион (8). Соединение **8** выделено при хроматографировании реакционной массы полученной в результате ацетилирования соединения **3**. Выход 0.042 г (12%) оранжевых кристаллов, т.пл. 162–163°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1645 с (C=O), 1678 с (C=O). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 2.65 с (3H, CH_3), 6.28 д (1H, H_{α} , J 1.4 Гц), 6.82 д

(1H, H_{β} , J 2.2 Гц), 7.72 д.д (1H, $H_{\text{хин}}^8$, J 4.5 Гц), 7.90 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^3$, J 4.1 Гц), 7.95 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^4$, J 4.1 Гц), 8.25 д (1H, $H_{\text{хин}}^4$, J 8.9 Гц), 8.33 д (1H, $H_{\text{хин}}^5$, J 9.0 Гц), 8.75 д (1H, $H_{\text{хин}}^9$, J 8.1 Гц), 8.93 д (1H, $H_{\text{хин}}^7$, J 3.2 Гц). Найдено, %: C 61.17; H 3.64; N 8.12. $C_{18}H_{12}N_2O_2S_2$. Вычислено, %: C 61.34; H 3.43; N 7.95.

Фенил-[5-([1,3]тиазоло[4,5- f]хинолин-2-ил)тиофен-2-ил]метанон (9). Смесь 0.268 г (1 ммоль) соединения **3** и 0.37 г (3 ммоль) бензойной кислоты в 5 г ПФК перемешивали 10 ч при 150–160°C. Далее выделение продукта реакции проводили аналогично соединению **6**. Соединение **9** кристаллизовали из 1-пропанола. Выход 0.23 г (61%) кремовых кристаллов, т.пл. 145–146°C. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1645 с (C=O). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6), δ , м.д.: 7.53 т (3H, $H_{\text{арил}}^{3,4,5}$, J 7.5 Гц), 7.72 д.д (1H, $H_{\text{хин}}^8$, J 4.5 Гц), 7.90 д (2H, $H_{\text{арил}}^{6,7}$, J 7.2 Гц), 7.94 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^3$, J 4.0 Гц), 7.97 д (1H, $H_{\text{тиофен}}^4$, J 4.0 Гц), 8.25 д (1H, $H_{\text{хин}}^4$, J 8.9 Гц), 8.33 д (1H, $H_{\text{хин}}^5$, J 9.0 Гц), 8.79 д (1H, $H_{\text{хин}}^9$, J 8.1 Гц), 8.96 д (1H, $H_{\text{хин}}^7$, J 3.2 Гц). Найдено, %: C 67.53; H 3.49; N 7.33. $C_{21}H_{12}N_2OS_2$. Вычислено, %: C 67.72; H 3.25; N 7.52.

КОНФЛИКТ ИНТЕРЕСОВ

Авторы заявляют об отсутствии конфликта интересов.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

- Pozharskii A.F., Soldatenkov A.T., Katritzky A.R. *Heterocycles in Life and Society*. Chichester: J. Wiley & Sons, **1997**, 382.
- Marujama T., Kuroki N., Konishi K. *Nippon Kagaku Zasshi*. **1965**, *68*, 2428.
- Рошаль А.Д., Лукьянов Б.С., Ельчанинов М.М. *ЖФХ*. **2003**, *77*, 1899–1905. [Roshal A.D., Lukianov B.S., Elchaninov M.M. *Russ. J. Phys. Chem. A*. **2003**, *77*, 1709–1714.]
- Jacobson P. *Ber.* **1886**, *19*, 1067–1077. doi 10.1002/cber.188601901239
- Fărcășan V., Makkay C. *Acad. Rep. Populare Române, Filiala Cluj, St. Cerc. Chim.* **1959**, *10*, 145–150.
- Александров А.А., Дедечева А.С., Власова Е.В., Ельчанинов М.М. *ЖОрХ*. **2011**, *47*, 121–124. [Aleksandrov A.A., Dedeneva A.S., Vlasova E.V., Elchaninov M.M. *Russ. J. Org. Chem.* **2011**, *47*, 120–123.] doi 10.1134/S1070428011010155
- Fărcășan V., Paiu F. *Studia Univ. Babeş-Bolyai. Ser. Chem.* **1971**, *16*, 111–115.

Synthesis and Reactivity Relative 2-(Thiophene-2-yl)[1,3]thiazolo[4,5-*f*]quinoline

A. A. Aleksandrov*, D. A. Zablotsky, and M. M. Elchaninov

*South Russian state polytechnic university (NPI) named after M.I. Platov,
346428, Russia, Novocherkassk, ul. Prosvescheniya 132*

**e-mail: aaanet1@yandex.ru*

Received June 21, 2019; revised November 12, 2019; accepted November 22, 2019

Condensation of quinoline-5-amine with thiophene-2-carbonyl chloride in 2-propanol synthesized *N*-(quinoline-5-yl)thiophene-2-carboxamide. Treatment of which, P₂S₅ in anhydrous pyridine obtained the corresponding thioamide. Oxidation of the latter by potassium ferricyanide in an alkaline medium synthesized 2-(thiophene-2-yl)[1,3]thiazolo[4,5-*f*]quinoline. Further, the annelation product was introduced in the electrophilic substitution reaction: nitration, sulfonation, bromination, formylation, acylation. The substituent enters exclusively into position 5 of the thiophene core. When acetylation is observed the formation of two derivatives: methylketone and diketone with properley methylene group.

Keywords: quinoline-5-amine, *N*-(quinoline-5-yl)thiophene-2-carboxamide and *N*-(quinoline-5-yl)thiophene-2-carbotioamide, oxidation, potassium ferricyanide, electrophilic substitution reactions