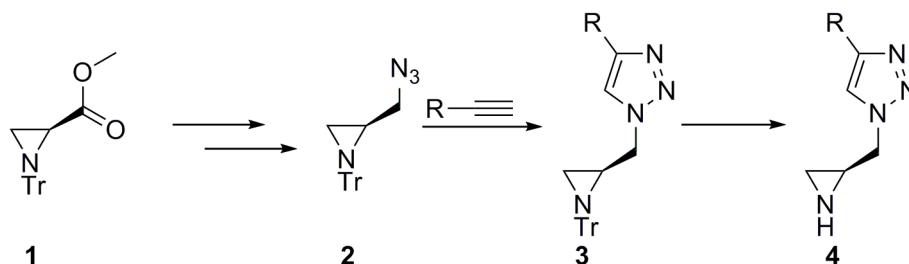


Homohirāli aziridīni ar triazola aizvietotāju sānu ķēdē

Mūsu interesi par aziridīna atvasinājumu sintēzi veicināja fakts, ka vairāk nekā 130 aziridīna ciklu saturoši savienojumi ir uzrādījuši apstiprinātu farmakoloģisko aktivitāti. Bez tam aziridīnam piekonjugētais 1,4-diazvietotais 1,2,3-triazola cikls ir peptīdsaite izostērs, t.i. pēc telpā aizņemtās vietas, tas ir pielīdzināms peptīdsaietei.



Kopsummā uzsintezēti 10 dažādi aziridīna triazola konjugāti **3** no kuriem četri savienojumi tika deaizsargāti un attīrīti, lai tiem noteiktu bioloģisko aktivitāti.

Sintēze sāka no *N*-tritolaziridīna-2-karbonskābes metilestera (**1**), no kā 3 stadiju sintēzē iegūts attiecīgais azīds **2**, kas vara(I) katalizētā Huisgena ciklopievienošanas reakcijā deva attiecīgos produktus **3**. Šo savienojumu apstrāde ar trifluoretiķskābi dod attiecīgos deaizsargātos aziridīna triazola konjugātus **4**.