

Секция 2
ОРГАНИЧЕСКАЯ ХИМИЯ, БИОХИМИЯ
И БИОТЕХНОЛОГИЯ

ИЗУЧЕНИЕ НЕКОТОРЫХ ПРЕВРАЩЕНИЙ МЕТИЛ N-4-[[3-(2-ТИЕНИЛ)-2-ПРОПЕНОИЛ]ФЕНИЛ]КАРБАМАТА

Ионова В.А., Великородов А.В., Мокляк М.М.

Астраханский государственный университет
414000, Астрахань, пл. Шаумяна, 1
org@aspu.ru

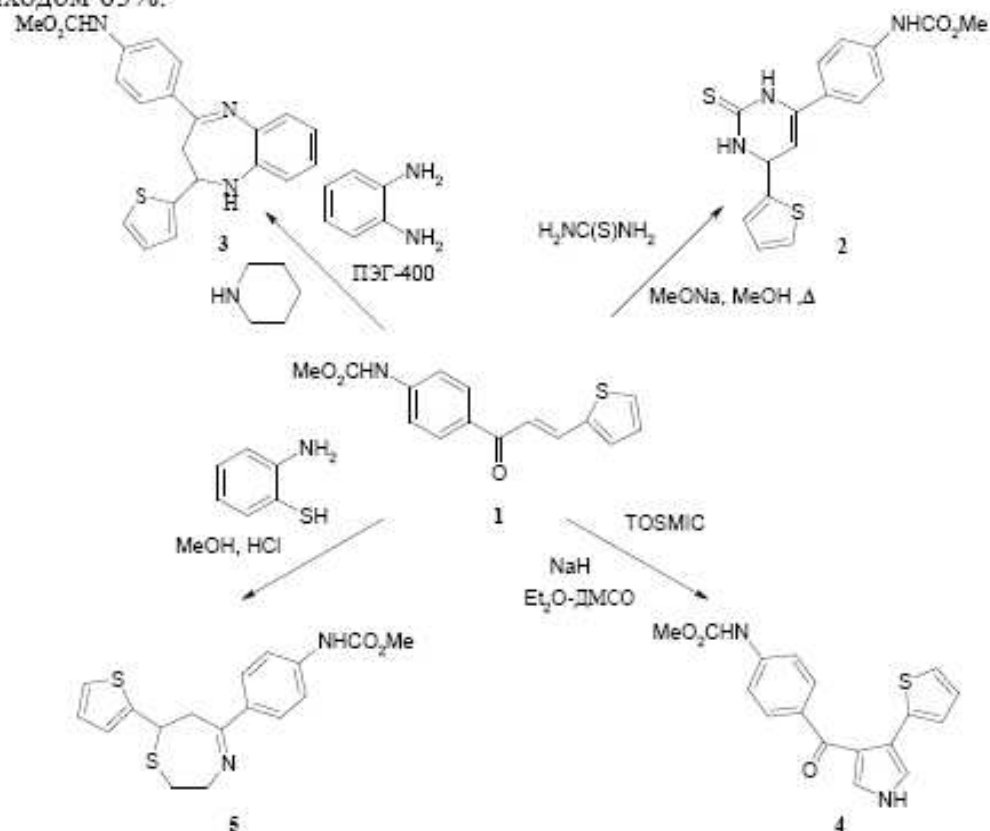
Халконы или *транс*-1,3-диарил-2-пропен-1-оны являются ключевыми соединениями в синтезе многих биологически важных гетероциклов, в частности, бензотиазепинов, пиразолинов, пиримидинов, флавонов, изоксазолинов и других соединений.

Среди α,β -ненасыщенных кетонов и их производных найдены вещества, проявляющие цитотоксичность по отношению к различным линиям раковых клеток [1,2], антимитотическую [3], антимуtagenную [4], противомикробную [5], противовирусную [6], противовоспалительную [7], противогрибковую [8], гепатопротекторную [9] и другие виды активности.

В этой связи синтез новых халконов и азотсодержащих гетероциклических соединений на их основе представляется важной задачей. Нами изучены некоторые химические превращения метил N-4-[[3-(2-тиенил)-2-пропеноил]фенил]карбамата (1).

Установлено, что конденсация халкона (1) с тиомочевинной в присутствии метоксида натрия при кипячении в метаноле в течение 3 ч приводит к получению метил N-{4-[6-(2-тиенил)-2-тиоксо-1,2,3,6-тетрагидро-4-пиримидинил]фенил}карбамата (2) с выходом 74%. В ИК спектре соединения (2) присутствуют полоса поглощения тиокарбонильной группы при 1163 см^{-1} , полосы поглощения при 3310 и 3240 см^{-1} , обусловленные валентными колебаниями связи NH карбаматной и амидных групп. В спектре ЯМР ^1H соединения (2) сигналы протонов H^5 , H^6 гетероцикла проявляются в виде дублетов соответственно при 5.74 и 5.20 м.д., а сигналы NH групп пиримидинового цикла находятся при 8.67 м.д., что указывает на преимущественное существование тиокарбонильной группы таутомерной формы. Конденсацией соединения (1) с *o*-фенилендиамином в полиэтиленгликоле в присутствии пиперидина посредством выдержки реакционной массы при 60°C получено производное 1,5-бензодиазепина (3) с выходом 68%. Найдено, что конденсация халкона (1) с 2-аминотифенолом в метаноле в

присутствии конц. HCl приводит к получению 1,5-бензотиазепина (5) с выходом 65%.



Взаимодействие халкона (1) с *n*-тозилметилизотиоцианидом в присутствии основания гидрида натрия приводит к получению производного пиррола (4) с выходом 82%. Структура новых соединений (3-5) подтверждена методами ЯМР ^1H , ^{13}C спектроскопии.

Литература

1. Konieczny M.T., Konieczny W., Sabisz M., Skladanowski A., Wakiec R., Augustynowicz-Kopec E., Zwolska Z. *Eur. J. Med. Chem.* **2007**, 42, 729.
2. Kumar D., Kumar N.M., Akamatsu K., Kusaka E., Harada H., Ito T. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2010**, 20, 3916.
3. Ducki S., Forrest R., Hadfield J.A., Kendall A., Lawrence N.J., McGrown A.T., Remison D. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **1998**, 8, 1051.
4. Wegmuller M., von der Wied J.P., Oberson P., Gisin N., Edenharder R., Petersdorff I.V., Rauscher R. *Mutat. Res.* **1993**, 9, 261.
5. Pandeya S.N., Sriram D., Nath G., DeClercq E. *Eur. J. Med. Chem.* **1999**, 9, 25.
6. Biradar J.S., Sasidhar B.S., Parveen R. *J. Med. Chem.* **2010**, 45, 4074.
7. Nowakowska Z. *Eur. J. Med. Chem.* **2007**, 42, 125.
8. Cherkupally S.R., Dassari C.R., Vookanti Y., Adki N. *Org. Commun.* **2010**, 3, 57.
9. Sabzevari O., Mahmoudian S., Minaei B., Paydar H. *Toxicol. Lett.* **2010**, 196, 213.