

В результате было обнаружено, что образуются производные тетрагидротиофена **4**, которые имеют циклическую структуру. Их строение было доказано с помощью данных спектроскопии ЯМР ^1H и ^{13}C и масс-спектрометрии. В настоящее время проводится исследование влияния заместителей в олефинах и изоцианидах на протекание данной реакции.

1. Mironov M.A., Ivantsova M.N., Mokrushin V.S. Synlett.- 2006.- Vol. 4. P. 615.

Работа выполнена при поддержке совместных грантов Рособразования (грант РНП.2.2.2.3.8017, АБЦП "Развитие научного потенциала высшей школы 2009-2010") и Американского Фонда поддержки Гражданских Исследований и Развития (Y5-C-05-08).

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ ЭТИЛ 3-ФЕНИЛКАРБОКСАМИДОТИЕНО[2,3-*b*]ПИРИДИН-2-КАРБОКСИЛАТА С ПЕРВИЧНЫМИ АМИНАМИ

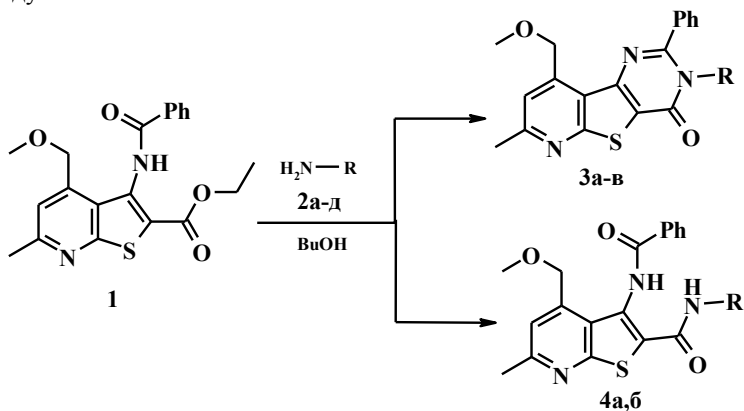
Пятак Е.Е., Костенко Е.С., Кайгородова Е.А.

Кубанский государственный аграрный университет, Краснодар

Известно, что взаимодействие 2-алкоксикарбонил-3-карбоксамидотиено[2,3-*b*]пиридинов с первичными аминами или гидразином приводит к образованию 3,4-дигидро-пиридотиенопиримидин-4-онов. Методология построения пиримидинового кольца заключается в последовательном формировании связей N(3)-C(4) и C(2)-N(3). Реакция проходит через стадию образования в положении 2 карбоксамидной (гидразидной) группировки, далее следует гетероциклизация в пиримидин-4(3*H*)-оны [1, 2].

Установлено, что взаимодействие этил 3-фенилкарбоксамидотиено[2,3-*b*]-пиридин-2-карбоксилата **1** с первичными аминами **2a-d** протекает неоднозначно. Так, кипячение соединения **1**

с аминами **2а-в** в бутаноле, как мы и ожидали, приводит к замыканию пиримидинового цикла и образованию 3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-онов **3а-в**. Выход продуктов составляет 56-67%.



2а, 3а R=*n*-Bu; **2б, 3б** R²=C₂H₄OH; **2в, 3в** R²=(CH₂)₃N(C₂H₅)₂;
2г, 4а R²=CH₂Ad¹; **2д, 4б** R²=(CH₂)₂OAd¹

При проведении реакции в тех же условиях между амидом **1** и 1-адамантилметиламином **2г** или 2-(1-адамантилокси)этиламином **2д** реакция выделены *N*2-(1-адамантилметил)- и *N*2-[2-(1-адамантилокси)этил]-3-фенил-карбоксамидотиено[2,3-*b*]пиримидин-2-карбоксамидов **4а,б** (выход 47 и 59%). Образование ациклических структур, по-видимому, объясняется стерической перегруженностью молекул, затрудняющей реакцию гетероциклизации.

Пиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-оны **3б,в** проявляют антимикробную активность в отношении культуры *Staphylococcus aureus* 209P [3].

1. Leistner S. Пат. 293826 ГДР. *РЖХим.* 1992 15 О 89 П.

2. Дабаева В.В. *ХГС*, 6, 847, (1997).

3. Костенко Е.С. *Хим-фарм. журн.*, 42 (9), 37 (2008).