

**КАТАЛИТИЧЕСКОЕ ЦИКЛОАМИНОМЕТИЛИРОВАНИЕ
АЛКИЛАМИНОВ С ПОМОЩЬЮ *N,N'*-
БИС[(ДИМЕТИЛАМИНО)МЕТИЛ](ТИО)КАРБАМИДОВ**

Гениятова А.Р., Хайруллина Р.Р., Каримова Л.Д.,

Ибрагимов А.Г., Джемилев У.М.

Институт нефтехимии и катализа УНЦ РАН

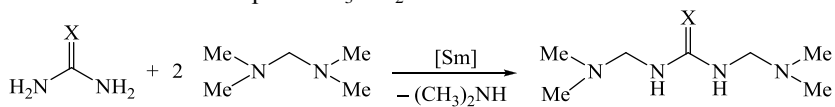
450075, г. Уфа, пр. Октября, д. 141

Тел/факс: (347)2842750. E-mail: ink@anrb.ru

Замещенные 1,3,5-триазины находят практическое применение в качестве пестицидов, биопротекторов топлив и смазочных масел, биологически активных соединений, а также могут быть использованы как синтоны при получении алкалоидов с противоопухолевыми свойствами.

Одним из наиболее известных способов синтеза 5-замещенных 1,3,5-триазиан-2-онов и 5-замещенных 1,3,5-триазиан-2-тионов является классическая реакция Манниха аминометилирования (тио)карбамидов с помощью первичных аминов и формальдегида. Данный метод имеет ряд ограничений, связанных с применением водного раствора формальдегида, проведением реакции при повышенной (90–100°C) температуре и ее низкой селективностью.

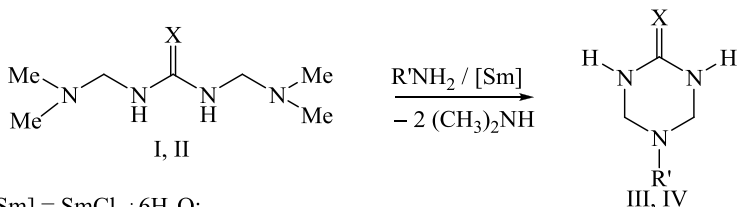
С целью разработки нового и эффективного метода синтеза 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-онов и 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-тионов нами изучено циклоаминометилирование алкиламинов с помощью *N,N'*-бис[(диметиламино)метил](тио)карбамидов в присутствии солей и комплексов d,f-элементов. Для осуществления приведенной выше реакции предварительно мы разработали удобный способ синтеза *N,N'*-бис[(диметиламино)метил](тио)карбамидов (I,II) аминометилированием (тио)карбамидов с помощью бис(*N,N*-диметиламино)метана с участием в качестве катализатора $\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$.



X = O (I); X = S (II); [Sm] = $\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O}$

I, II

Установили, что реакция циклоаминометилирования алкиламинов с помощью *N,N'*-бис[(диметиламино)метил](тио)-карбамидов в условиях $(\text{RNH}_2:(\text{I,II}):\text{SmCl}_3 \cdot 6\text{H}_2\text{O} = 10:10:0.5, 80^\circ\text{C}, \text{EtOH}, 8\text{ч})$ приводит к селективному образованию 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-онов и 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-тионов (III,IV).



[Sm] = SmCl₃ · 6H₂O;

X = O (I, III); X = S (II, IV); R' = *cyclo*-C₆H₁₁; *t*-Bu; HO(CH₂)₂; *i*-Pr

Таким образом, реакция циклоаминометилирования первичных алкиламинов с помощью *N,N'*-бис[(диметиламино)метил]-(тио)карбамидов с участием Sm-содержащих катализаторов может быть с успехом использована для селективного синтеза 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-онов и 5-алкил-1,3,5-триазиан-2-тионов.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (проекты 11-03-00101-а, 11-03-97011-р_Поволжье_а).

СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ 2-МЕТОКСИЭСТРАДИОЛА КАК ПОТЕНЦИАЛЬНЫХ ПРОТИВООПУХОЛЕВЫХ ВЕЩЕСТВ

Глазкова Я.С., Нуриева Е.В., Зефирова О.Н.

Московский государственный университет

119991, г. Москва, Ленинские горы, д. 1

В рамках исследований по синтезу необычных аналогов известного противоопухолевого препарата колхицина в 2011 году был получен его конъюгат с адамантаном [1]. Это соединение проявило высокую цитотоксичность по отношению к клеткам карциномы легких A549 и необычный механизм действия на микротубулярную сеть. Задачей данного исследования явилась разработка схем синтеза аналогов указанного конъюгата, в которых колхициновая группировка заменена фрагментом другого вещества с противоопухолевой активностью – 2-метоксиэстрадиола.

Синтезы целевых соединений осуществляли по представленной общей схеме: