

СЕКЦИЯ ОРГАНИЧЕСКОЙ ХИМИИ

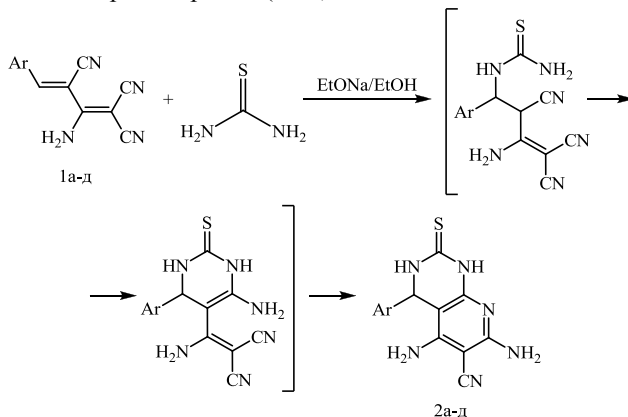
СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ТЕТРАГИДРОПИРИДО[2,3-*D*]ПИРИМИДИНА

Алексеева А.Ю., Михайлов Д.Л., Бардасов И.Н.

Чувашский государственный университет
428015, г. Чебоксары, Московский пр., д. 15

Пиримидиновое кольцо, несомненно, принадлежит к наиболее важным гетероциклическим соединениям в природе. Многие природные и синтетические производные пиримидина являются фармакологически активными соединениями, среди которых особое место занимают серосодержащие производные конденсированных пиридопиримидинов. Так, у некоторых их представителей были выявлены противовоспалительная, обезболивающая, антимикробная [1, 2] и противоопухолевая активности [3].

Благодаря наличию атома азота amino- или цианогруппы, а также енаминдинитрильного фрагмента, который дает дополнительные возможности для дальнейших каскадных превращений, арилиденпроизводные димера малонодинитрила **1** являются удобными субстратами для синтеза конденсированных азотосодержащих циклов. В ходе исследования было установлено, что при взаимодействии соединений **1** с тиомочевинной в присутствии этилата натрия происходит образование 5,7-диамино-4-арил-2-тио-1,2,3,4-тетрагидропиридо[2,3-*d*]пиримидин-6-карбонитрилов (**2а-д**) с выходом 60%.



Ar = C₆H₅ (а), 2-ClC₆H₄ (б), 3-ClC₆H₄ (в), 4-FC₆H₄(г), 4-CH₃C₆H₄ (д).

Образование соединений 2а-д происходит в результате последовательных превращений. На первом этапе взаимодействия, по-видимому, происходит нуклеофильное присоединение тиомочевины по двойной связи. Далее следует серия каскадных внутримолекулярных превращений с участием амино- и цианогрупп, в результате чего образуются конденсированные пиридопиримидины 2а-д.

Строение соединений 2а-д доказано методами ИК, ЯМР ^1H , ЯМР ^{13}C спектроскопии и масс-спектрометрией.

1. El-Gazzar A.-R.B.A., Hafez H.N. Synthesis of 4-substituted pyrido[2,3-d]pyrimidin-4(1H)-one as analgesic and anti-inflammatory agents // Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters. 2009. V.19. № 13. P. 3392-3397.

2. El-Gazzar A.-R.B.A., Hafez H.N., Nawwar G.A.M. New acyclic nucleosides analogues as potential analgesic, anti-inflammatory, anti-oxidant and anti-microbial derived from pyrimido[4,5-b]quinolones // European Journal of Medicinal Chemistry. 2009. V.44. № 4. P. 1427-1436.

3. Ghorab M.M., Ragab F.A., Hamed M.M. Design, synthesis and anticancer evaluation of novel tetrahydroquinoline derivatives containing sulfonamide moiety // European Journal of Medicinal Chemistry. 2009. V. 44. № 10. P. 4211-4217.

СИНТЕЗ И РЕАКЦИЯ ОКИСЛИТЕЛЬНОЙ ЦИКЛИЗАЦИИ НЕСИММЕТРИЧНЫХ

БИС-АРИЛГИДРАЗОНОАЦЕТАМИДИНОВ

Аникин А.К., Лесогорова С.Г., Бельская Н.П.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Ранее мы предложили метод синтеза бис-амидино-бис-гидразонов реакцией взаимодействия соединений **3** с диаминами в этаноле [1]. Целью настоящей работы явилась разработка метода синтеза бис-амидинов, содержащих различные по электронным эффектам заместители в ароматическом цикле, и изучение влияния структуры на их физико-химические свойства.

Мы осуществили синтез несимметричных бис-амидинов **5** последовательным превращением малондинитрила **2**, и взаимодействием полученных продуктов **3** с соединениями **4**.

Окислительная циклизация полученных бис-арилгидразоноацетамидинов **5** в присутствии ацетата меди (II) приводит к бис-2H-1,2,3-триазолам **6**.