

DR-63

**КАТАЛИТИЧЕСКОЕ [6 π +2 π] ЦИКЛОПРИСОЕДИНЕНИЕ
N-ЗАМЕЩЕННЫХ АЗЕПИНОВ К АЛКИНАМ И АЛЛЕНАМ
ПОД ДЕЙСТВИЕМ CO(ACAC)₂(DPPE)/ZN/ZNI₂**

У. М. Джемилев, Г. Н. Кадикова, В. А. Дьяконов, Л. У. Джемилева

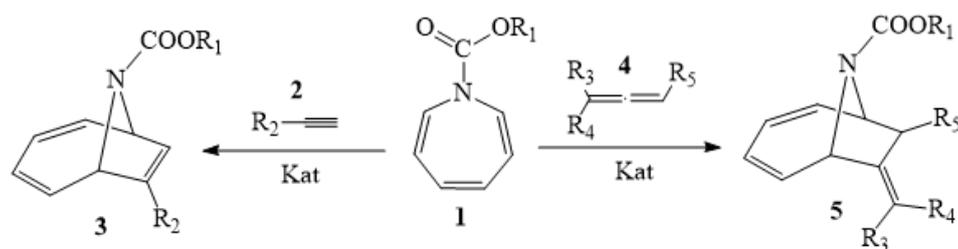
Институт нефтехимии и катализа РАН, 450075, Россия,

г. Уфа, пр. Октября, 141.

E-mail: Kad.Gulnara@gmail.com

Химия семичленных N-гетерокарбоциклов (азепинов) является одной из важных и востребованных областей исследования современной органической химии¹. На основе азепинов и их производных разработан ряд эффективных лекарственных препаратов, широко используемых сегодня в медицинской практике, например, антидепрессантов и транквилизаторов (кломипрамин, карбамазепин, нитразепам, феназепам, диазепам). По этой причине изучение реакций циклоприсоединения с участием N-замещенных азепинов характеризуется высокой актуальностью. Кроме того, указанные превращения приводят к формированию практически важного класса азакарбоциклов – 9-азабицикло[4.2.1]нонади(три)енов. 9-Азабицикло[4.2.1]нонановый остов является структурным ядром ряда алкалоидов, таких как анатоксин-а, пиннамин, бис-гомо-эпибатидин, обладающих широким спектром биологической активности.

Нами обнаружено, что [6 π +2 π]-циклоприсоединение N-карбоэтокси(фенокси)азепинов **1** к терминальным алкинам **2** под действием каталитической системы Co(acac)₂(dppe)/Zn/ZnI₂ приводит к образованию замещенных 9-азабицикло[4.2.1]нона-2,4,7-триенов **3** с высокими выходами (75–96%)². Аналогично проходит циклосодимеризация азепинов **1** с алленами **4** с образованием 9-азабицикло[4.2.1]нона-2,4-диенов **5** (75–95%).



Kat = Co(acac)₂(dppe)/Zn/ZnI₂

R₁ = Et, Ph; R₂ = Alk, Ar, (CH₂)_nOH, (CH₂)_nCN, 1-naphtyl, 1-phenanthrenyl, 2-

phthalimidoethyl(butyl), n = 2, 4; R₃ = H, CH₃; R₄ = Hex, Ar, (CH₂)₄OH; R₅ = H; R₄= R₅ = -(CH₂)₆-

Синтезированные 9-азабицикло[4.2.1]нонади(три)ены проявили высокую противоопухолевую активность *in vitro* в отношении опухолевых клеточных линий Jurkat, K562 и U937.

Библиографический список

1. Дьяконов В. А. Химия 1,3,5-циклогептатриенов с участием комплексов переходных металлов / В. А. Дьяконов, Г. Н. Кадикова, У. М. Джемилев // Успехи химии. – 2018. – Т. 87, № 8. – С. 797–820.
2. Targeted synthesis of 9-azabicyclo[4.2.1]nona-2,4,7-trienes by cobalt(I)-catalyzed [6 π +2 π]-cycloaddition of alkynes to N-substituted azepines and their antitumor activity / V. A. D'yakonov, G. N. Kadikova, R. N. Nasretdinov, L. U. Dzhemileva, U. M. Dzhemilev // Eur. J. Org. Chem. – 2020. – Iss. 5. – P. 623– 626.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФ (проект № 19-73-10116) и РФФИ (проект № 19-03-00393).