

## Синтез и превращения 2-(3'-R<sup>3</sup>-3'-оксо-1'-фенил пропил)-3-оксопропантиоамидов

**Бриун В.Н.**  
**Курмач М.Н.**  
**Майборода Е.И.\***

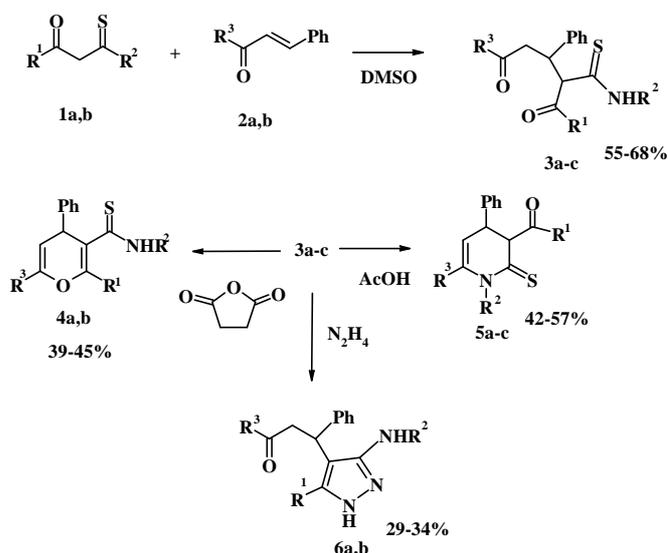
Институт органической химии НАН Украины  
 02094 Украина, г. Киев-94, ул. Мурманская, 5; ioch@ioch.kiev.ua  
 \* Киевский национальный университет технологий и дизайна,  
 01011 Украина, г. Киев, ул. Немировича-Данченка, 2

Известно, что 2-ацилтиоацетамиды являются полифункциональными субстратами, способными вступать в реакции как с ди-нуклеофильными, так и с диэлектрофильными и полицентровыми реагентами [1,2].

Поэтому данный класс соединений широко используется для синтеза различных азот- и серусодержащих гетероциклов, в том числе - биологически активных [1].

Мы установили, что тиоамиды **1a,b** вступают в реакцию по Михаэлю с халконами **2a,b**, превращаясь в 2-(3'-R<sup>3</sup>-3'-оксо-1'-фенилпропил)-3-оксопропантиоамиды **3a-c**.

Следует отметить, что обычно метиленак-тивны тиоацетамиды в конденсациях с халконами и подобными соединениями сразу же дают производные дигидропиридинтиона. Выделить же промежуточные соединения, как правило, не удается [ 1 ] .



R<sup>1</sup> = Ph, Me; R<sup>2</sup> = Ph, Me; R<sup>3</sup> = Ph, Me

Последние являются привлекательными сходными соединениями для реакций закрытия цикла.

Так, в присутствии янтарного ангидрида происходит внутримолекулярная циклизация 3-оксопропантиоамидов **3a-c** с участием их карбонильных групп, сопровождающаяся образованием 3-тиокарбамоил-4-фенил-4R-пиранов **4a,b**.

При кипячении раствора 3-оксопропантиоамидов **3a-c** в уксусной кислоте внутримолекулярная дегидратация протекает по иному пути - затрагивая их МП и С=О группы. Продуктами этой реакции являются 3-ацил-4-фенил-1,2,3,4-тетрагидропиридин-2-тионы **5a-c**.

2-(3'-R<sup>3</sup>-3'-оксо-1'-фенилпропил)-3-оксо-пропантиоамиды **3a-c** в уксусной кислоте взаимодействуют с гидразингидратом, превращаясь в 4-(3'-R<sup>3</sup>-3'-оксо-1'-фенилпропил)-3-(R<sup>2</sup>-амино)-5-R<sup>1</sup>-1H-пиразолы **6a,b**.

Строение синтезированных соединений подтверждено данными спектроскопии ЯМР <sup>1</sup>H, ИК, а состав - данными элементного анализа.

Таким образом, нами впервые синтезированы 2-(3'-К<sup>3</sup>-3'-оксо-1'-фенилпропил)-3-оксопропантиоамиды **3а-с** и показано, что они являются новыми перспективными стартовыми реагентами для синтеза пяти- и шестичленных гетероциклов.

**Литература:**

- [1] Брицун В.М. 2-Функционализированные метиленактивные тиацетамиды. - Киев: Компринт, 2012.- 173 с.
- [2] Брицун В.Н., Есипенко А.Н., Пироженко В.В., Лозинский М.О., ХГС, 1216 (2008).