

СИНТЕЗ 4-АРИЛ-5-ТИОКАРБАМОИЛ-1,2,3,4-ТЕТРАГИДРОПИРИМИДИН-2-ОНОВ(ТИОНОВ) В РЕАКЦИИ БИДЖИНЕЛЛИ

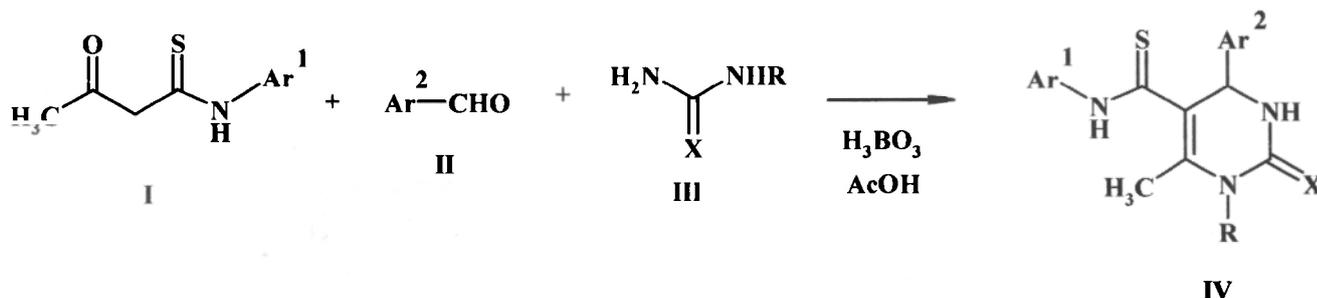
Н.В. Симурова¹, Е.И. Майборода¹, В.Н. Брицун²

¹Национальный университет пищевых технологий, Киев, Украина
e-mail: simurova@rambler.ru

²Институт органической химии НАН Украины, Киев, Украина

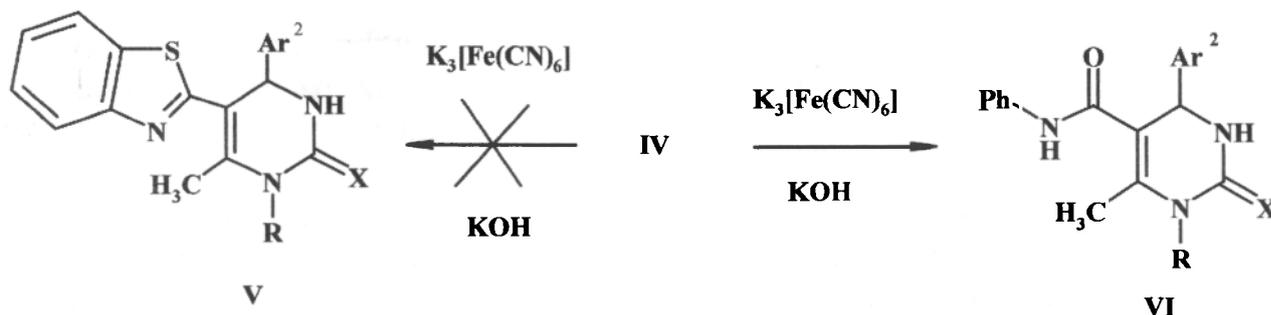
2-Ацилтиоацетамиды – полифункциональные реагенты, способные вступать в различные гетероциклизации как с диэлектрофильными, так и с динуклеофильными полицентровыми соединениями [1]. Вместе с тем, многокомпонентным реакциям с участием 2-ацилтиоацетамидов уделялось недостаточно внимания.

Нами впервые установлено, что 2-ацилтиоацетамиды **I** способны принимать участие в реакции Биджинелли – трехкомпонентной циклоконденсации соединений **I** с ароматическими альдегидами **II** и мочевиной (тиомочевиной) **III** в условиях гомогенного кислотного катализа. Реакция проходит селективно с образованием тетрагидропиримидинов **IV**:



R = H, CH₃; X = O, S; Ar¹ = Ph, 4-CH₃C₆H₄, 3-CF₃C₆H₄, 3-ClC₆H₄; Ar² = Ph, 1-нафтил,
4-C₂H₅OC₆H₄, 4-CH₃C₆H₄, 4-CF₃C₆H₄

Также установлено, что при окислении тетрагидропиримидинов **IV** проходит не закрытие цикла с образованием бензтиазольного фрагмента, а дитионирование и окисление с образованием амидной группы. Продуктами реакции при этом являются не ожидаемые 5-(бензтиазол-2'-ил)-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-оны **V**, а 5-(N-Ar¹-карбамоил)-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-оны **VI**.



Известно, что среди 3,4-тетрагидропиримидин-2-онов найдены вещества с противовирусными, противоопухолевыми, антигипертензивными свойствами [2]. В тоже время, полученные нами 4-арил-5-тиокарбамоил-3,4-тетрагидропиримидин-2(1H)-оны **IV** являются новыми полифункциональными синтонами, способными к дальнейшим химическим превращениям.

Структура продуктов реакции подтверждена методами ИК, ЯМР¹H и ЯМР¹³C спектроскопии, а состав – данными элементного анализа.

Литература

1. Брицун В.М. 2-Функционализированные метиленактивные тиоацетамиды. – Киев: ЦП "Компринт", 2012. – 173 с.
2. Вдовина С. В., Мамедов В.А. // Успехи химии. – 2008. – Т.77. – С.1091-1102.