

А. С. Толкунов,* С. Л. Богза

РЕАКЦИЯ ПИКТЕ–ШПЕНГЛЕРА В СИНТЕЗЕ КОНДЕНСИРОВАННЫХ БЕНЗОДИАЗЕПИНОВ

2*. СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 11,12-ДИГИДРОХИНАЗОЛИН[3,2-с][2,3]- БЕНЗОДИАЗЕПИН-14(6Н)-ОНОВ

На основе реакции Пикте–Шпенглера 3-амино-2-(3,4-диметоксибензил)хиназолин-4(3Н)-она с алифатическими и гетероциклическими альдегидами в кислой среде синтезированы новые производные дигидрохиназолин[3,2-с][2,3]бензодиазепин-14(6Н)-онов.

Ключевые слова: 3-амино-2-(1,4-бензодиоксан-6-илметил)хиназолин-4(3Н)-он, 3-амино-2-(3,4-диметоксибензил)хиназолин-4(3Н)-он, конденсированные диазепины, дигидрохиназолин[3,2-с][2,3]бензодиазепин-14(6Н)-оны, реакция Пикте–Шпен-глера, циклизация.

Реакция Пикте–Шпенглера широко используется в синтезе тетрагидроизохинолинов и их гетероаналогов – тетрагидро-β- и тетрагидро-γ-карболинов, тетрагидробензофуоро[2,3-с]- и тетрагидробензотиено[2,3-с]пиридинов [2–4], а также многих алкалоидов изохинолинового и β-карболинового рядов [5–7]. До настоящего времени она продолжает широко использоваться в разных модификациях [8–10].

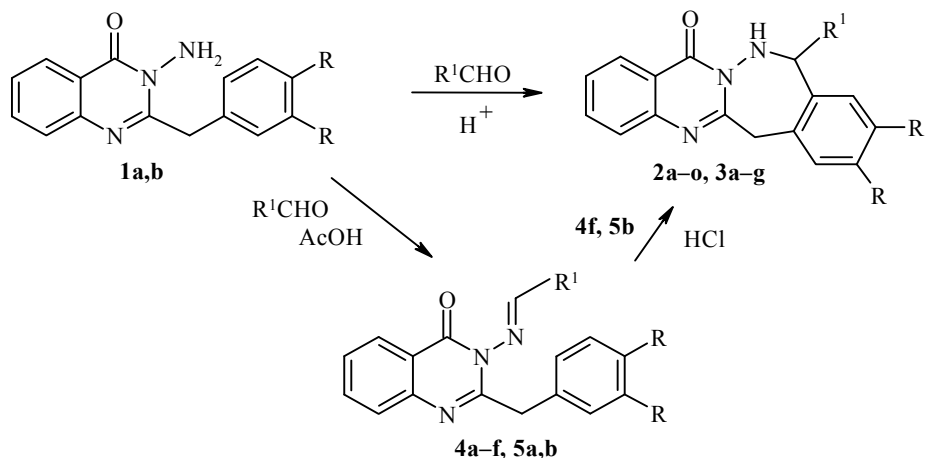
Необходимо отметить, что реакция Пикте–Шпенглера использовалась в основном для аннелирования пиридинового цикла и не применялась для получения 1,2-бензодиазепиновых производных.

В предыдущей публикации [1] нами был предложен новый подход к синтезу поликонденсированных диазепинов, основанный на образовании 1,2-дiazепинового цикла при взаимодействии 3-амино-2-(3,4-диметоксибензил)хиназолин-4(3Н)-она (**1a**) и 3-амино-2-(1,4-бензодиоксан-6-илметил)хиназолин-4(3Н)-она (**1b**) с ароматическими альдегидами и параформом в условиях реакции Пикте–Шпенглера.

В настоящей публикации исследованы границы применения этой реакции с использованием широкого круга алифатических, гетероциклических и функционализированных карбонильных соединений. В качестве циклизующих агентов использовали соляную (метод А) и трифторуксусную (метод Б) кислоты.

Взаимодействие 3-аминохиназолинонов **1a,b** с алифатическими альдегидами (уксусный, пропионовый, масляный, фенилацетальдегид) в соляной кислоте проходит в течение 10–30 мин. Диазепины **2a–c,f** образуются

* Сообщение 1 см. [1].



1 a R = OMe, **b** R = OCH₂CH₂O; **2a-o** R = OMe, **a** R¹ = Me, **b** R¹ = Et, **c** R¹ = Pr,
d R¹ = ClCH₂, **e** R¹ = CH₂Br, **f** R¹ = CH₂Ph, **g** R¹ = C₆H₅, **h** R¹ = бензофурил-2,
i R¹ = бензофурил-3, **j** R¹ = 5-нитрофурил-2, **k** R¹ = 4-бромтиенил-2, **l** R¹ = 5-хлортиенил-2,
m R¹ = пиридил-3, **n** R¹ = хинолил-2, **o** R¹ = хинолил-4; **3a-g** R = OCH₂CH₂O, **a** R¹ = Et,
b R¹ = ClCH₂, **c** R¹ = бензофурил-2, **d** R¹ = бензофурил-3, **e** R¹ = 4-бромтиенил-2,
f R¹ = пиридил-4, **g** R¹ = хинолил-4; **4a-g** R = OMe, **a** R¹ = индолил-3,
b R¹ = 1-метилиндолил-3, **c** R¹ = 1-бензилиндолил-3, **d** R¹ = 1,2-диметилиндолил-3,
e R¹ = тиенил-2, **f** R¹ = 5-пропилтиенил-2, **g** 5-метилфурил-2-; **5a,b** R = OCH₂CH₂O,
a R¹ = 5-хлортиенил-2, **b** R¹ = 4-бромтиенил-2

с выходами до 80%. Из-за возможности альдольных конденсаций этих альдегидов в кислых средах они были взяты в стехиометрических количествах. Реакция амина **1a** с 1,1-диметокси-2-хлорэтаном и 2-бром-1,1-дибутоксизтаном в соляной кислоте приводит к 11-хлорметил- и 11-бромметилзамещенному диазепинам (**2d** и **2e**) с выходами не менее 90%. Проведение реакции в трифторуксусной кислоте в случае алифатических альдегидов не применимо из-за низких выходов и образования полимерных продуктов.

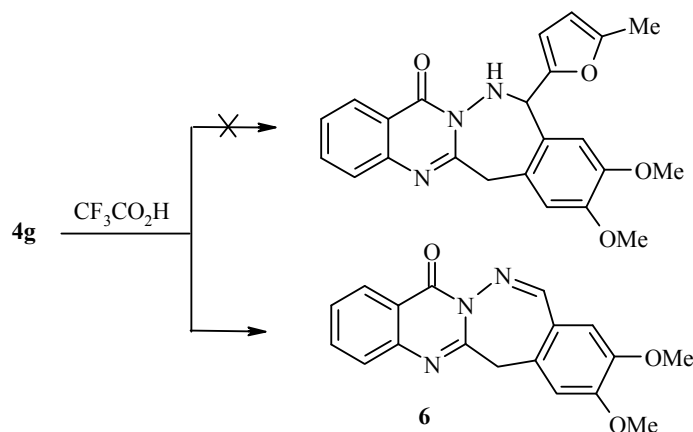
Гетероциклические альдегиды индольного ряда – индол-3-карбоксальдегид, 2-метилиндол-3-карбоксальдегид, 1-метил- и 1-бензилиндол-3-карбоксальдегид, 1,2-диметилиндол-3-карбоксальдегид, а также фурфурол и тиофен-2-карбоксальдегид не образуют соответствующих диазепинов ни по методу А, ни по методу Б. Так, при кипячении смеси амина **1a** и альдегидов ряда индола в трифторуксусной кислоте в течение 4–5 ч выделены альдимины **4a–d**. В соляной кислоте наблюдается лишь осмоление альдегидов и из реакционной смеси удастся выделить только исходный амин **1a**. Длительное кипячение (8–10 ч) альдиминов **4a–c** в соляной и трифторуксусной кислотах приводит к полимерным продуктам, что связано с неустойчивостью полностью замещенного пиррольного цикла в кислых средах, а альдимин **4d** даже при кипячении 24 ч в соляной и трифторуксусной кислотах выделен в неизменном виде, что связано с низкой активностью этого альдимина из-за электронодонорного влияния пиррольного цикла.

Фурфурол и тиофен-2-карбоксальдегид также неустойчивы в сильно-

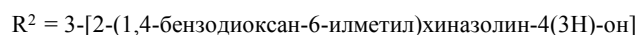
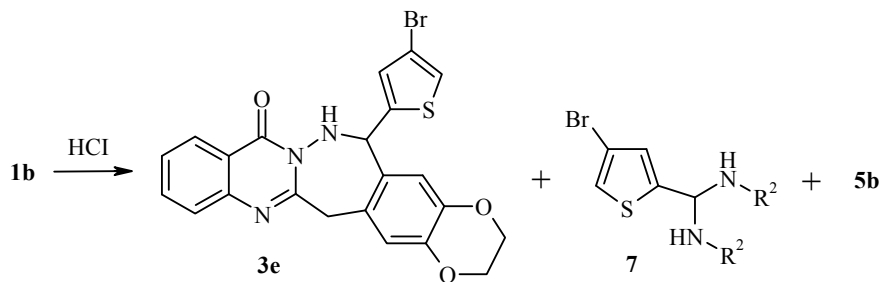
кислых средах [11, 12] и не образуют диазепинов ни по методу А, ни по методу Б. Попытки циклизации альдимины **4e** в трифторуксусной и в соляной кислотах также не привели к успеху. Более устойчивый 5-пропилтиофен-2-карбоксальдегид с амином **1a** в соляной кислоте образует диазепин с выходом около 10% (по данным интегральных интенсивностей сигналов в спектрах ЯМР ^1H), который в чистом виде выделить не удалось. Образование диазепинов легко регистрируется по характерным дублетам протонов Н-6 в спектрах ЯМР ^1H с $J = 12\text{--}13$ Гц и синглетам ароматических протонов Н-7 и Н-10.

В противоположность индол-3-карбоксальдегиду изостерные бензо[*b*]-фуран-2-карбоксальдегид и бензо[*b*]фуран-3-карбоксальдегид гладко вступают в реакцию, давая диазепины **2h,i** и **3c,d**. Нитрогруппа в фурановом кольце (5-нитрофурурол) повышает устойчивость фуранового цикла, так же как галогены стабилизируют тиофеновый цикл в 5-хлортиофен-2-карбоксальдегиде и 4-бромтиофен-2-карбоксальдегиде, что позволяет получать соответствующие диазепины **2j-l**.

Неожиданным оказался результат реакции 5-метилфурфуrolа с амином **1a**. При нагревании предварительно полученного основания Шиффа **4g** в трифторуксусной кислоте был выделен хиназолин[3,2-*c*][2,3]бензодиазепин-14(6H)-он (**6**), что согласуется с результатами работы [9]. В спектре ЯМР ^1H диазепина **6** протоны группы 6-CH_2 проявляются в виде синглета при 3.95 м. д.



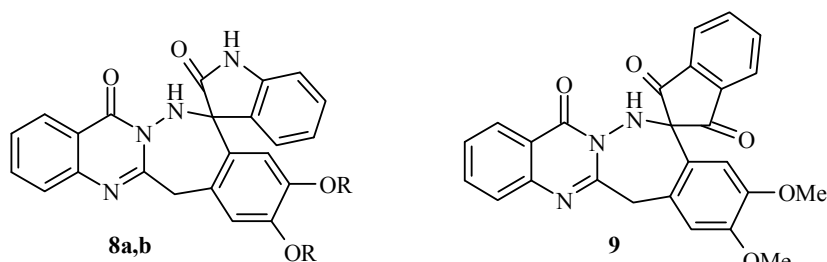
Экспериментально нами было показано, что активность к электрофильному замещению 1,4-бензодиазепинового фрагмента в аминокиназолиноне **1b** уступает по активности 3,4-диметоксифенильному фрагменту. Так, при нагревании амина **1b** с 4-бромтиофен-2-карбоксальдегидом в соляной кислоте (метод А) в течение 4 ч после обработки реакционной смеси были выделены диазепин **3e** (30%), азометин **5b** (50%) и аминаль **7** (20%). При кипячении смеси в течение 10 ч реакционная смесь частично осмолается, а диазепин **3e** образуется с выходом 30%. В тех же условиях (нагревание 4 ч) из аминокиназолинона **1a** и 4-бромтиофен-2-карбоксальдегида соответствующий диазепин **2k** получен с выходом 63%.



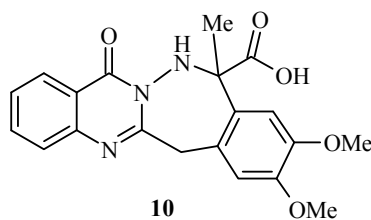
Ещё менее активен 5-хлортиофен-2-карбоксальдегид, который с аминохиназолином **1b** в соляной кислоте образует только азометин **5a**. Соответствующий диазепин идентифицирован в спектре ЯМР ^1H лишь в следовых количествах.

Шестичленные гетероароматические альдегиды ряда пиридина и хинолина гладко реагируют с N-аминопроизводными **1a,b**, образуя диазепины **2m-o**, **3f,g**. Реакцию проводят в соляной кислоте при $80\text{ }^\circ\text{C}$ в течение 3–4 ч.

α -Дикарбонильные соединения, такие как фенилглиоксаль, нингидрин, изатин, дают хорошие выходы диазепинов **2g**, **8**, **9**. Этиловый эфир пировиноградной кислоты в процессе реакции гидролизуеться, в результате чего выделено карбоксипроизводное **10** с выходом, близким к количественному.



8 a R = Me, **b** R = OCH₂CH₂O



10

Ацетофенон и циклогексанон с амином **1a** не образуют диазепинов ни в соляной, ни в трифторуксусной кислотах. При нагревании смеси ацетофенона и амина **1a** в трифторуксусной кислоте в течение 24 ч была выделена смесь 2-(3,4-диметоксибензил)-3-(1-фенилэтилиденамино)хиназолин-4(3H)-она (**11**) и исходного **1a** в соотношении 39% (m/z 414.2 $[\text{M}+1]^+$) и 61% (m/z 312.3 $[\text{M}+1]^+$), по данным хромато-масс-спектрального анализа и спектра ЯМР ^1H .

Таблица 1

Характеристики синтезированных соединений 2–11

| Соединение | Брутто-формула | Найдено, % Вычислено, % | | | | | | Т. пл., °С | $t_{\text{реакс}}$ ч | Выход, %* |
|------------|-------------------------|----------------------------|---------------------|-----------------------|-----------------------|---------------------|----------------------|------------|-------------------------|-----------|
| | | C | H | Нlg | N | S | | | | |
| 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | 10 | |
| 2a | $C_{19}H_{19}N_3O_3$ | <u>67.91</u> 67.64 | <u>5.35</u> 5.68 | | <u>12.37</u> 12.45 | | 177 | 1 | 70 | |
| 2b | $C_{20}H_{21}N_3O_3$ | <u>68.64</u> 68.36 | <u>5.91</u> 6.02 | | <u>12.01</u> 11.96 | | 139 | 1 | 80 | |
| 2c | $C_{21}H_{23}N_3O_3$ | <u>68.93</u> 69.02 | <u>6.51</u> 6.34 | | <u>11.72</u> 11.50 | | 127 | 1 | 80 | |
| 2d | $C_{19}H_{18}ClN_3O_3$ | <u>61.14</u> 61.38 | <u>4.73</u> 4.88 | <u>9.42</u> 9.53 | <u>11.35</u> 11.30 | | 195–196 | 1 | 98 | |
| 2e | $C_{19}H_{18}BrN_3O_3$ | <u>54.59</u> 54.82 | <u>4.52</u> 4.36 | <u>19.10</u> 19.19 | <u>10.16</u> 10.09 | | 193 | 1 | 95 | |
| 2f | $C_{25}H_{23}N_3O_3$ | <u>72.87</u> 72.62 | <u>5.76</u> 5.61 | | <u>10.37</u> 10.16 | | 174 | 1 | 65 | |
| 2g | $C_{25}H_{21}N_3O_4$ | <u>70.34</u> 70.25 | <u>5.13</u> 4.95 | | <u>9.81</u> 9.83 | | 282–285 (с разл.) | 8 | 65 | |
| 2h | $C_{26}H_{21}N_3O_4$ | <u>71.21</u> 71.06 | <u>4.66</u> 4.82 | | <u>9.60</u> 9.56 | | 238–239 | 3.5 | 72 | |
| 2i | $C_{26}H_{21}N_3O_4$ | <u>71.16</u> 71.06 | <u>4.55</u> 4.82 | | <u>9.49</u> 9.56 | | 147–148 | 8 | 67 | |
| 2j | $C_{22}H_{18}N_4O_6$ | <u>60.67</u> 60.83 | <u>4.00</u> 4.18 | | <u>13.02</u> 12.90 | | Разл. > 230 | 8 | 69 | |
| 2k | $C_{22}H_{18}BrN_3O_3S$ | <u>54.88</u> 54.55 | <u>3.72</u> 3.75 | <u>16.57</u> 16.50 | <u>8.63</u> 8.68 | <u>6.78</u> 6.62 | 222 | 8 | 63 | |

| | | | | | | | | | |
|-----------|-------------------------|----------------|--------------|----------------|----------------|--------------|----------------------|----------|----------|
| 2l | $C_{22}H_{18}ClN_3O_3S$ | 60.34 60.07 | 3.99 4.12 | 8.01 8.06 | 9.59 9.55 | 7.43 7.29 | 201–202 | 3.5 9 | 40 50 |
| 2m | $C_{23}H_{20}N_4O_3$ | 68.83 68.99 | 5.16 5.03 | | 14.10 13.99 | | 202–203 | 8 | 46 |
| 2n | $C_{27}H_{22}N_4O_3$ | 72.11 71.99 | 5.03 4.92 | | 12.58 12.44 | | Разл. > 188 | 3.5 | 50 |
| 2o | $C_{27}H_{22}N_4O_3$ | 72.16 71.99 | 4.98 4.92 | | 12.53 12.44 | | 256–257 (с разл.) | 3.5 | 85 |
| 3a | $C_{20}H_{19}N_3O_3$ | 68.93 68.75 | 5.39 5.48 | | 12.17 12.03 | | 225 | 1 | 94 |
| 3b | $C_{19}H_{16}ClN_3O_3$ | 61.61 61.71 | 4.11 4.36 | 9.67 9.59 | 11.23 11.36 | | 233–234 | 1 | 72 |
| 3c | $C_{26}H_{19}N_3O_4$ | 71.45 71.39 | 4.12 4.38 | | 9.68 9.61 | | 233–234 | 4 | 69 |
| 3d | $C_{26}H_{19}N_3O_4$ | 71.56 71.39 | 4.49 4.38 | | 9.59 9.61 | | 253–255 | 4 | 70 |
| 3e | $C_{22}H_{16}BrN_3O_3S$ | 54.92 54.78 | 3.21 3.34 | 16.43 16.57 | 8.91 8.71 | 6.75 6.65 | 233–235 | 10 | 30 |
| 3f | $C_{23}H_{18}N_4O_3$ | 69.51 69.34 | 4.63 4.55 | | 13.98 14.06 | | 241–242 (с разл.) | 4 | 80 |
| 3g | $C_{27}H_{20}N_4O_3$ | 72.37 72.31 | 4.33 4.49 | | 12.55 12.49 | | Разл. > 260 | 4 | 80 |
| 4a | $C_{26}H_{22}N_4O_3$ | 71.32 71.22 | 5.00 5.06 | | 12.74 12.78 | | 234 | 4 | 27 |
| 4b | $C_{27}H_{24}N_4O_3$ | 71.66 71.67 | 5.12 5.35 | | 12.41 12.38 | | 175 | 5 | 50 |
| 4c | $C_{33}H_{28}N_4O_3$ | 75.08 74.98 | 5.53 5.34 | | 10.68 10.60 | | 206 | 5 | 50 |
| 4d | $C_{28}H_{26}N_4O_3$ | 72.13 72.09 | 5.53 5.62 | | 12.11 12.01 | | 200–202 | 24 | 82 |

Окончание таблицы 1

| 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 6 | 7 | 8 | 9 | 10 |
|----|-------------------------|-----------------------|---------------------|-----------------------|-----------------------|---------------------|----------------------|--------|----------|
| 4e | $C_{22}H_{19}N_3O_3S$ | $\frac{64.91}{65.17}$ | $\frac{4.92}{4.72}$ | | $\frac{10.39}{10.36}$ | $\frac{7.92}{7.91}$ | 163 | | 60 |
| 4f | $C_{25}H_{25}N_3O_3S$ | $\frac{67.20}{67.09}$ | $\frac{5.58}{5.63}$ | | $\frac{9.54}{9.39}$ | $\frac{7.01}{7.16}$ | 109 | | 64 |
| 4g | $C_{23}H_{21}N_3O_4$ | $\frac{68.56}{68.47}$ | $\frac{5.08}{5.25}$ | | $\frac{10.40}{10.42}$ | | 103 | | 59 |
| 5a | $C_{22}H_{16}ClN_3O_3S$ | $\frac{60.56}{60.34}$ | $\frac{3.84}{3.68}$ | $\frac{8.04}{8.10}$ | $\frac{9.52}{9.60}$ | $\frac{7.44}{7.32}$ | 134–135 | 4 | 60 |
| 5b | $C_{22}H_{16}BrN_3O_3S$ | $\frac{54.61}{54.78}$ | $\frac{3.59}{3.34}$ | $\frac{16.42}{16.57}$ | $\frac{8.67}{8.71}$ | $\frac{6.61}{6.65}$ | 166–167 | 4 | 50 |
| 6 | $C_{18}H_{15}N_3O_3$ | $\frac{68.95}{68.86}$ | $\frac{6.13}{6.16}$ | | $\frac{10.78}{10.71}$ | | 233–235 (с разл.) | 6 | 40 |
| 7 | $C_{39}H_{31}BrN_6O_6S$ | $\frac{59.24}{59.17}$ | $\frac{4.02}{3.95}$ | $\frac{10.17}{10.09}$ | $\frac{10.54}{10.62}$ | $\frac{4.21}{4.05}$ | 221–223 | 4 | 20 |
| 8a | $C_{25}H_{20}N_4O_4$ | $\frac{68.31}{68.17}$ | $\frac{4.66}{4.58}$ | | $\frac{12.65}{12.72}$ | | 284 | 8 | 70 |
| 8b | $C_{25}H_{18}N_4O_4$ | $\frac{68.39}{68.49}$ | $\frac{3.99}{4.14}$ | | $\frac{12.61}{12.78}$ | | Разл. > 305 | 4 | 70 |
| 9 | $C_{26}H_{19}N_3O_5$ | $\frac{68.82}{68.87}$ | $\frac{4.43}{4.22}$ | | $\frac{9.41}{9.27}$ | | 259 | 1 8 | 96 67 |
| 10 | $C_{20}H_{19}N_3O_5$ | $\frac{63.04}{62.99}$ | $\frac{4.97}{5.02}$ | | $\frac{11.20}{11.02}$ | | Разл. > 160 | 1 | 100 |
| 11 | $C_{25}H_{23}N_3O_3$ | $\frac{72.44}{72.62}$ | $\frac{5.72}{5.61}$ | | $\frac{10.27}{10.16}$ | | 212–213 | 24 | 38.8 |

* Выходы соединений 2a–o, 3a–g, 4a–d, 5a, b, 6, 7, 8a, b и 9–11, полученных методами А и Б. Выходы по методу Б выделены курсивом.

Спектры ЯМР ^1H синтезированных соединений

| Соединение | Химический сдвиг, δ , м. д. (J , Гц) |
|------------|--|
| 1 | 2 |
| 2a | 1.49 (3H, д, $J = 6.8$, CH_3); 3.70 и 3.78 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 3.87 и 4.79 (2H, уш. д, H-6); 4.50 (1H, к, $J = 6.8$, H-11); 6.58 (1H, с, H-7); 6.71 (1H, уш. с, NH); 6.74 (1H, с, H-10); 7.41 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.54 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.69 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.11 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2b | 1.04 (3H, т, $J = 6.8$, CH_3); 1.91 и 2.05 (2H, м, $J = 6.8$, CH_2Me); 3.60 и 5.04 (2H, д, $J = 13.2$, 6- CH_2); 3.70 и 3.79 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.40 (1H, м, H-11); 6.54 (1H, уш. с, NH); 6.57 (1H, с, H-7); 6.74 (1H, с, H-10); 7.40 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.53 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.67 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.10 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2c | 1.02 (3H, т, $J = 6.8$, CH_3); 1.48 и 1.68 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Me}$); 1.92 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Me}$); 3.63 и 5.06 (2H, д, $J = 13.2$, H-6); 3.73 и 3.82 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.44 (1H, м, H-11); 6.56 (1H, уш. с, NH); 6.57 (1H, с, H-7); 6.77 (1H, с, H-10); 7.43 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.56 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.71 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.13 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2d | 3.74 и 3.83 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 3.68 и 5.07 (2H, д, $J = 12.8$, H-6); 3.85 и 4.31 (2H, д, $J = 11.6$, CH_2Cl); 4.72 (1H, м, H-11); 6.82 (1H, с, H-7); 6.84 (1H, с, H-10); 7.44 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.57 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.72 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.15 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2e | 3.72 и 3.80 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 3.65 и 5.06 (2H, уш. д, H-6); 3.76 и 4.22 (2H, д, $J = 10.8$, CH_2Br); 4.70 (1H, м, H-11); 6.83 (1H, с, H-7); 6.85 (1H, с, H-10); 7.44 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.57 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.72 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.11 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2f | 3.13 (1H, д, д, $J = 7.4$, $J = 8.0$, CH_2Ph); 3.31 (1H, д, д, $J = 7.4$, $J = 4.4$, CH_2Ph); 3.55 и 4.93 (2H, д, $J = 12.8$, H-6); 3.65 и 3.82 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.75 (1H, м, H-11); 6.51 (1H, д, $J = 2.4$, NH); 6.60 (1H, с, H-7); 6.75 (1H, с, H-10); 7.25–7.30 (5H, м, C_6H_5); 7.39 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.53 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.67 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.07 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2g | 3.09 (2H, с, H-6); 3.57 и 3.96 (6H, с, 8 и 9- OCH_3); 6.33 (1H, с, H-7); 7.17 (1H, д, $J = 1.6$, H-11); 7.34 (1H, т, $J = 7.6$, H-4'); 7.47 (2H, т, $J = 7.6$, H-3',5'); 7.59 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.74 (3H, м, H-4,2',6'); 7.84 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.99 (1H, уш. с, NH); 8.08 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2h | 3.60 и 3.84 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.45 (2H, уш. с, H-6); 5.85 (1H, с, H-11); 6.48 (1H, уш. с, NH); 6.57 (1H, с, H-7); 6.93 (1H, с, H-10); 7.14 (1H, т, $J = 8.0$, H-5' бензофуран); 7.21 (1H, т, $J = 8.0$, H-6' бензофуран); 7.30 (1H, с, H-3' бензофуран); 7.38 (2H, м, H-2,7' бензофуран); 7.44 (1H, д, $J = 8.0$, H-4' бензофуран); 7.59 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.72 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.92 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2i | 3.56 и 3.85 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.09 и 5.14 (2H, уш. д, 6- CH_2); 5.81 (1H, с, H-11); 6.52 (1H, с, H-7); 6.90 (1H, уш. с, NH); 6.96 (1H, с, H-10); 7.12 (1H, уш. т, H-5' бензофуран); 7.26 (1H, т, $J = 8.0$, H-6' бензофуран); 7.45 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.51 (2H, м, H-4',7' бензофуран); 7.62 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.76 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.95 (1H, уш. с, H-2' бензофуран); 8.07 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2j | 3.68 и 3.87 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.11 и 4.96 (2H, д, $J = 12.8$, 6- CH_2); 5.92 (1H, д, $J = 2.4$, H-11); 6.19 (1H, уш. с, NH); 6.61 (1H, с, H-7); 6.95 (1H, с, H-10); 7.31 (1H, д, $J = 4.0$, H-3' фуран); 7.44 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.61 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.65 (1H, уш. д, H-4' фуран); 7.76 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.00 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2k | 3.61 и 3.81 (6H, с, 8- и 9- OCH_3); 4.18 и 4.69 (2H, д, $J = 12.4$, 6- CH_2); 5.90 (1H, д, $J = 2.4$, H-11); 6.50 (1H, с, H-7); 6.90 (1H, с, H-10); 7.09 (1H, с, H-3'); 7.14 (1H, уш. с, NH); 7.35 (1H, с, H-5'); 7.43 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.58 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.73 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.04 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |

| 1 | 2 |
|-----------|--|
| 2l | 3.62 и 3.82 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 4.13 и 4.74 (2H, д, $J = 13.2$, 6-CH ₂); 5.83 (1H, д, $J = 2.4$, H-11); 6.51 (1H, с, H-7); 6.83 (1H, д, $J = 4.0$, H-4'); 6.89 (1H, с, H-10); 6.96 (1H, д, $J = 4.0$, H-3'); 7.09 (1H, уш. с, NH); 7.44 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.59 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.74 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.06 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 2m | 3.53 и 3.81 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 4.21 и 4.82 (2H, д, $J = 12.0$, CH ₂); 5.64 (1H, д, $J = 2.0$, H-11); 6.31 (1H, с, H-7); 6.94 (1H, с, H-10); 7.07 (1H, уш. с, NH); 7.19 (1H, т, $J = 5.2$, H-5'); 7.42 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.47 (1H, уш. д, H-6'); 7.59 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.73 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.98 (1H, д, $J = 8.0$, H-1); 8.42 (1H, д, $J = 5.2$, H-4'); 8.51 (1H, с, H-2') |
| 2n | 3.47 и 3.80 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 4.22 и 4.93 (2H, д, $J = 13.2$, CH ₂); 5.82 (1H, д, $J = 2.4$, H-11); 6.45 (1H, с, H-7); 7.02 (1H, с, H-10); 7.30 (1H, уш. с, NH); 7.33 (1H, д, $J = 8.0$, H-5'); 7.42 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.56 (1H, т, $J = 8.0$, H-7'); 7.63 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.69 (1H, т, $J = 8.0$, H-6'); 7.76 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.85 (1H, д, $J = 8.0$, H-3'); 7.89 (1H, д, $J = 8.0$, H-8'); 7.93 (1H, д, $J = 8.0$, H-1); 8.21 (1H, д, $J = 8.0$, H-4') |
| 2o | 3.43 и 3.84 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 4.10 и 5.11 (2H, д, $J = 13.2$, CH ₂); 6.26 (1H, с, H-11); 6.35 (1H, уш. с, NH); 7.01 (2H, с, H-7,10); 7.07 (1H, уш. с, H-7'); 7.45 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.62 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.71–7.81 (3H, м, H-2,5',6'); 8.04 (1H, д, $J = 8.0$, H-1); 8.08 (1H, д, $J = 8.0$, H-3'); 8.66 (1H, уш. д, H-8'); 8.74 (1H, уш. д, H-2') |
| 3a | 1.02 (3H, т, $J = 6.8$, CH ₂ CH ₃); 1.89 и 2.05 (2H, м, $J = 6.8$, CH ₂ Me); 3.89 и 5.02 (2H, д, $J = 12.8$, 6-CH ₂); 4.20 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 4.38 (1H, уш. м, H-11); 5.92 (1H, уш. с, NH); 6.57 (1H, с, H-7); 6.76 (1H, с, H-10); 7.53 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.74 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.82 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.15 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 3b | 3.83 и 4.96 (2H, д, $J = 12.8$, H-6); 3.89 и 4.19 (2H, м, CH ₂ Cl); 4.19 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 4.69 (1H, уш. м, H-11); 5.23 (1H, уш. с, NH); 6.79 (1H, с, H-7); 6.80 (1H, с, H-10); 7.51 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.66 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.79 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.13 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 3c | 4.16 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 4.41 (2H, уш. с, H-6); 5.82 (1H, с, CH); 6.50 (1H, с, H-7); 6.58 (1H, уш. с, NH); 6.90 (1H, с, H-10); 7.14 (1H, т, $J = 8.0$, H-5' бензофуран); 7.18 (1H, д, $J = 8.0$, H-4' бензофуран); 7.22 (1H, т, $J = 8.0$, H-6' бензофуран); 7.40 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.45 (1H, с, H-3' бензофуран); 7.49 (1H, д, $J = 8.0$, H-7' бензофуран); 7.61 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.75 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.89 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 3d | 3.94 и 5.07 (2H, уш. д, 6-CH ₂); 4.10 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 5.67 (1H, с, CH); 6.41 (1H, с, H-7); 6.78 (1H, уш. с, NH); 6.81 (1H, с, H-10); 7.06 (1H, уш. т, H-5' бензофуран); 7.19 (1H, т, $J = 8.0$, H-6' бензофуран); 7.39 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.42 (2H, м, H-4',7' бензофуран); 7.55 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.70 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.92 (1H, уш. с, H-2' бензофуран); 8.02 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 3e | 4.05 и 4.73 (2H, уш. с, 6-CH ₂); 4.17 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 5.81 (1H, уш. с, H-11); 6.45 (1H, с, H-7); 6.78 (1H, с, H-10); 7.09 (1H, с, H-3'); 7.31 (1H, с, H-5'); 7.42 (1H, т, $J = 8.0$, H-2); 7.56 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.71 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 8.06 (1H, д, $J = 8.0$, H-1) |
| 3f | 4.03 и 4.88 (2H, д, $J = 13.2$, CH ₂); 4.15 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 5.49 (1H, с, H-11); 6.25 (1H, с, H-7); 6.82 (1H, с, H-10); 6.90 (1H, с, NH); 7.25 (2H, д, $J = 5.6$, H-3',5'); 7.40 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.57 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.70 (1H, д, $J = 8.0$, H-2); 8.04 (1H, д, $J = 8.0$, H-1); 8.46 (2H, д, $J = 5.6$, H-2',6') |
| 3g | 3.99 и 5.13 (2H, д, $J = 13.2$, CH ₂); 4.13 (4H, м, OCH ₂ CH ₂ O); 6.18 (1H, с, H-11); 6.23 (1H, уш. с, NH); 6.90 (1H, с, H-7); 6.97 (1H, с, H-10); 7.19 (1H, уш. с, H-7'); 7.45 (1H, т, $J = 8.0$, H-3); 7.61 (1H, д, $J = 8.0$, H-4); 7.67–7.79 (3H, м, H-2,5',6'); 8.07 (2H, м, H-1,3'); 8.56 (1H, уш. д, H-8'); 8.77 (1H, уш. д, H-2') |

| 1 | 2 |
|----|---|
| 4a | 3.14 и 3.65 (6H, с, 3',4'-OCH ₃); 4.22 (2H, с, CH ₂); 6.67 (1H, д, $J = 8.4$, Н-5' вератрол); 6.69 (1H, с, Н-2' вератрол); 6.77 (1H, д, $J = 8.4$, Н-6' вератрол); 7.23 (2H, м, Н-5',6' индол); 7.49 (2H, м, Н-6, Н-7' индол); 7.69 (1H, д, $J = 8.4$, Н-8); 7.77 (1H, т, $J = 8.4$, Н-7); 7.88 (1H, д, $J = 2.4$, Н-2' индол); 8.15 (1H, д, $J = 8.4$, Н-5); 8.27 (1H, д, $J = 8.4$, Н-4' индол); 8.51 (1H, с, CH=N); 11.91 (1H, с, NH индол) |
| 4b | 3.25 (3H, с, 1-CH ₃); 3.65 и 3.88 (6H, с, 3'-, и 4'-OCH ₃); 4.22 (2H, с, CH ₂); 6.76 (3H, с, Н-2',5',6' вератрол); 7.30 (2H, м, Н-5',6' индол); 7.57 (2H, м, Н-6,7' индол); 7.79 (2H, м, Н-7,8); 7.96 (1H, с, Н-2' индол); 8.19 (2H, м, Н-5,4' индол); 8.60 (1H, с, CH=N) |
| 4c | 3.20 и 3.68 (6H, с, 3'- и 4'-OCH ₃); 4.24 (2H, с, CH ₂); 5.49 (2H, с, CH ₂ бензил); 6.65 (1H, д, $J = 8.4$, Н-5' вератрол); 6.72 (1H, с, Н-2' вератрол); 6.78 (1H, д, $J = 8.4$, Н-6' вератрол); 7.26 (5H, м, Н бензил); 7.33 (2H, м, Н-5',6' индол); 7.45 (2H, м, Н-6,7' индол); 7.69 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.74 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 7.96 (1H, с, Н-2' индол); 8.17 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.32 (1H, д, $J = 8.0$, Н-4' индол); 8.53 (1H, с, CH=N) |
| 4d | 2.45 (3H, с, 2-CH ₃); 3.20 (3H, с, 1-CH ₃); 3.70 и 3.80 (6H, с, 3'- и 4'-OCH ₃); 4.21 (2H, с, CH ₂); 6.65 (1H, с, Н-2' вератрол); 6.67 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5' вератрол); 6.76 (1H, д, $J = 8.0$, Н-6' вератрол); 7.24 (2H, м, Н-5',6' индол); 7.47 (2H, м, Н-6,7' индол); 7.70 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.77 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 8.16 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.26 (1H, д, $J = 8.0$, Н-4' индол); 8.43 (1H, с, CH=N) |
| 4e | 3.53 и 3.67 (6H, с, 3'- и 4'-OCH ₃); 4.13 (2H, с, CH ₂); 6.80 (3H, м, Н-2',5',6' вератрол); 7.26 (1H, т, $J = 4.8$, Н-4' тиофен); 7.53 (1H, т, $J = 8.0$, Н-6); 7.70 (2H, м, Н-8,5' тиофен); 7.83 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 7.95 (1H, д, $J = 4.8$, Н-3' тиофен); 8.14 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.95 (1H, с, CH=N) |
| 4f | 1.04 (3H, т, $J = 7.2$, CH ₃ CH ₂ CH ₂); 1.77 (2H, секст, $J = 7.2$, MeCH ₂ CH ₂); 2.89 (2H, т, $J = 7.2$, MeCH ₂ CH ₂); 3.53 и 3.70 (6H, с, 3'- и 4'-OCH ₃); 4.13 (2H, с, CH ₂); 6.70 (1H, д, $J = 8.4$, Н-5' вератрол); 6.81 (1H, с, Н-2' вератрол); 6.82 (1H, д, $J = 8.4$, Н-6' вератрол); 6.93 (1H, д, $J = 4.4$, Н-4' тиофен); 7.46 (2H, м, Н-6,3' тиофен); 7.67 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.77 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 8.14 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.79 (1H, с, CH=N) |
| 4g | 2.52 (3H, с, CH ₃); 3.60 и 3.73 (6H, с, 3'- и 4'-OCH ₃); 4.18 (2H, с, CH ₂); 6.33 (1H, д, $J = 2.8$, Н-4' фуран); 6.69 (1H, д, $J = 8.4$, Н-5'); 6.86 (1H, д, $J = 8.4$, Н-6'); 6.89 (1H, с, Н-2'); 7.05 (1H, д, $J = 2.8$, Н-3' фуран); 7.46 (1H, т, $J = 8.0$, Н-6); 7.67 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.75 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 8.15 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.52 (1H, с, CH=N) |
| 5a | 4.08 (2H, с, OCH ₂ CH ₂ O); 4.14 (4H, с, 2-CH ₂ , OCH ₂ CH ₂ O); 6.60 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5'); 6.70 (1H, д, $J = 8.0$, Н-6'); 6.75 (1H, с, Н-2'); 7.09 (1H, д, $J = 4.4$, Н-3' тиофен); 7.45 (1H, т, $J = 8.0$, Н-6); 7.49 (1H, д, $J = 4.4$, Н-4' тиофен); 7.65 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.75 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 8.14 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 8.96 (1H, с, CH=N) |
| 5b | 4.08 (2H, с, OCH ₂ CH ₂ O); 4.13 (4H, с, 2-CH ₂ и OCH ₂ CH ₂ O); 6.60 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5'); 6.70 (1H, д, $J = 8.0$, Н-6'); 6.75 (1H, с, Н-2'); 7.46 (1H, т, $J = 8.0$, Н-6); 7.60 (1H, с, Н-3' тиофен); 7.66 (1H, д, $J = 8.0$, Н-8); 7.76 (1H, т, $J = 8.0$, Н-7); 7.79 (1H, с, Н-5' тиофен); 8.15 (1H, д, $J = 8.0$, Н-5); 9.06 (1H, с, CH=N) |
| 6 | 3.79 и 3.86 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 3.95 (2H, с, Н-6); 7.23 (1H, с, Н-7); 7.30 (1H, с, Н-10); 7.53 (1H, т, $J = 8.0$, Н-2); 7.61 (1H, д, $J = 8.0$, Н-4); 7.80 (1H, т, $J = 8.0$, Н-3); 8.13 (1H, д, $J = 8.0$, Н-1); 8.91 (1H, с, CH=N) |
| 7 | 4.21 (8H, с, OCH ₂ CH ₂ O); 4.45 (4H, с, 2-CH ₂); 5.58 (2H, уш. с, NH); 6.73 (2H, д, $J = 8.0$, Н-5'); 7.03 (2H, д, $J = 8.0$, Н-6'); 7.08 (2H, с, Н-2'); 7.40 (1H, с, Н-3' тиофен); 7.53 (1H, с, CH); 7.55 (2H, м, Н-6); 7.65 (2H, с, Н-5' тиофен); 7.86 (2H, т, $J = 8.0$, Н-7); 8.00 (2H, д, $J = 8.0$, Н-8); 8.17 (2H, д, $J = 8.0$, Н-5) |

| 1 | 2 |
|-----------|--|
| 8a | 3.43 и 3.83 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 3.99 и 5.14 (2H, д, <i>J</i> = 13.2, H-6); 5.90 (1H, с, H-7); 7.04 (5H, м, NH, H-10,4',5',7' изатин); 7.36 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-6' изатин); 7.49 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-2); 7.67 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-4); 7.80 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-3); 8.05 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-1); 10.45 (1H, с, NH изатин) |
| 8b | 3.78 и 5.21 (2H, д, <i>J</i> = 13.2, H-6); 4.12 (2H, с, OCH ₂ CH ₂ O); 4.18 (2H, с, OCH ₂ CH ₂ O); 5.84 (1H, с, H-7); 6.90 (1H, с, H-10); 7.01 (3H, м, H-5',7' изатин, NH); 7.20 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-4' изатин); 7.35 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-6' изатин); 7.46 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-2); 7.62 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-4); 7.77 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-3); 8.05 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-1); 10.58 (1H, с, NH изатин) |
| 9 | 3.46 и 3.86 (6H, с, 8- и 9-OCH ₃); 4.02 и 5.26 (2H, уш. с, H-6); 5.04 (1H, уш. с, NH); 5.81 (1H, с, H-7); 7.01 (1H, с, H-10); 7.51 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-2); 7.72 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-4); 7.81 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-3); 8.10 (5H, м, H-1, H нингидрин) |
| 10 | 1.69 (3H, с, CH ₃); 3.07 (COOH в обмене с H ₂ O); 3.71 и 3.82 (6H, с, 8,9-OCH ₃); 4.05 и 4.66 (2H, уш. с, H-6); 6.58 (1H, с, NH); 6.80 (1H, с, H-7); 6.96 (1H, с, H-10); 7.42 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-2); 7.56 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-4); 7.71 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-3); 8.09 (1H, с, H-1) |
| 11 | 1.56 (3H, с, CH ₃); 3.14 (2H, с, CH ₂); 3.31 и 3.67 (6H, с, 3',4'-OCH ₃); 6.60 (1H, с, H-2' вератрол); 6.65 (1H, д, <i>J</i> = 8.4, H-6' вератрол); 6.69 (1H, д, <i>J</i> = 8.4, H-5' вератрол); 7.51 (3H, м, H-6,3',5'); 7.59 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-8); 7.75 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-4'); 7.82 (1H, т, <i>J</i> = 8.0, H-7); 7.96 (2H, д, <i>J</i> = 8.0, H-2',6'); 8.14 (1H, д, <i>J</i> = 8.0, H-5) |

Таким образом, разработанный нами метод получения 11-R-11,12-дигидрохиназолин[3,2-с][2,3]бензодиазепин-14(6H)-оносов **2**, **3**, **8–10** в условиях реакции Пикте–Шпенглера позволяет получать разнообразные алкил-, арил-, гетерил- и функциональнозамещённые конденсированные системы с фрагментом 2,3-бензодиазепина.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ¹H зарегистрированы на приборе Bruker Avance II 400 (400 МГц) в ДМСО-d₆, внутренний стандарт ТМС. Хромато-масс-спектры получены на спектрометре Agilent 1100 LC/MSD VL, способ ионизации АРСІ (химическая позитивная ионизация при атмосферном давлении). Параметры хроматографической колонки: длина 50 мм, диаметр 4.6 мм, неподвижная фаза – ZORBAX SB-C18, растворитель ацетонитрил–вода, 95:5, 0.1% трифторуксусная кислота, градиентное элюирование, скорость подачи растворителя 3.0 мл/мин. Характеристики синтезированных соединений приведены в табл. 1 и 2.

11-R-11,12-Дигидрохиназолин[3,2-с][2,3]бензодиазепин-14(6H)-оны (общая методика). А (Для соединений **2a–i,k–o**, **3a–g**, **8–10**). Смесь 2.5 ммоль соответствующего аминопроизводного **1a,b** и 2.5 ммоль карбонильного соединения в 10 мл соляной кислоты перемешивают при 80–90 °С (время реакции указано в табл. 1). Для лучшего растворения исходных соединений можно прибавлять 1–3 мл свежеперегнанного диоксана. При реакции с алифатическими альдегидами, нингидрином и этиловым эфиром пировиноградной кислоты осадок продукта реакции образуется уже в течение 10–20 мин. Реакционную смесь охлаждают, разбавляют водой и нейтрализуют 10% водным раствором аммиака до слабощелочной реакции (при получении диазепинов **2d,e**, **3a,b**, **10** – до pH 4–5). Оставляют смесь на 1 ч, кристаллы отфильтровывают и промывают водой.

Б (Для соединений **2g–o**, **3c–g**, **6**, **8**, **9**). Смесь 2.5 ммоль соответствующего

аминопроизводного **1a,b** и 2.5 ммоль карбонильного соединения в 4 мл трифторуксусной кислоты кипятят 8 ч. Далее обрабатывают как в методе А.

Соединения **2a–c,f** перекристаллизовывают из изопропилового спирта, **2g,j, 9** – из ДМФА, **2h,i,k–o, 3c–g, 6, 8** – из ацетона или смеси ацетон–изопропиловый спирт. Диазепин **10** пересаждают из содового раствора муравьиной кислотой.

3-Арилметилен-2-(3,4-диметоксибензил)аминохиназолин-4(3H)-оны (основания Шиффа) 4a–g, 5a,b (общая методика). Смесь 2.5 ммоль соответствующего аминопроизводного **1a,b** и 2.5 ммоль гетероароматического альдегида растворяют в 5 мл уксусной кислоты. Раствор кипятят 5 ч, охлаждают, разбавляют водой и нейтрализуют 10% водным раствором аммиака до слабощелочной реакции, осадок отфильтровывают. Соединения **4a–d** кристаллизуют из смеси ацетонитрил–изопропиловый спирт, **4e–g** – из изопропилового спирта, **5a,b** – из смеси бензол–гексан. Азометины **4a–d** были также получены по методу Б, а **5a,b** – по методу А.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. А. С. Толкунов, А. И. Хижан, С. Л. Богза, *XTC*, 745 (2010).
2. В. И. Дуленко, И. В. Комиссаров, А. Т. Долженко, Ю. А. Николокин, *β-Карболины. Химия и нейробиология*, Наукова думка, Киев, 1992, 216 с.
3. С. В. Толкунов, под ред. В. Г. Карцева, IBS-PRESS, Москва, 2003, т. 2, с. 444.
4. С. В. Толкунов, В. Ю. Попов, в кн. *Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов*, под ред. В. Г. Карцева, ICSPF-PRESS, Москва, 2006, т. 5, с. 123.
5. Э. Э. Шульц, Г. А. Толстиков, В. Г. Карцев, в кн. *Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов*, под ред. В. Г. Карцева, ICSPF-PRESS, Москва, 2006, т. 5, с. 273.
6. В. А. Тускаев, в кн. *Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов*, под ред. В. Г. Карцева, ICSPF-PRESS, Москва, 2006, т. 5, с. 166.
7. M. Shamma, in: *Organic Chemistry*, A. T. Blomquist, H. Wasserman (Eds.), Acad. Press, New York, 1972, vol. 25, 544 p.
8. E. D. Cox, J. M. Cook, *Chem. Rev.*, **95**, 1797 (1995).
9. S. L. Bogza, K. I. Kobrakov, A. A. Malienko, I. F. Perepichka, S. Yu. Sujkov, M. R. Bruce, S. B. Lyubchik, A. S. Batsanov, N. M. Bogdan, *Org. Biomol. Chem.*, **3**, 932 (2005).
10. S. Duggineni, D. Sawant, B. Saha, B. Kundu, *Tetrahedron*, **62**, 3228 (2006).
11. А. А. Пономарев, *Синтезы и реакции фурановых веществ*, Изд-во. Сарат. ун-та, 1960, с. 19.
12. Л. И. Беленький, в кн. *Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов*, под ред. В. Г. Карцева, IBS-PRESS, Москва, 2003, т. 2, с. 25.

Институт физико-органической химии
и углехимии им. Л. М. Литвиненко
НАН Украины, Донецк 83114, Украина
e-mail: s_tolkunov@yahoo.com

Поступило 29.05.2009