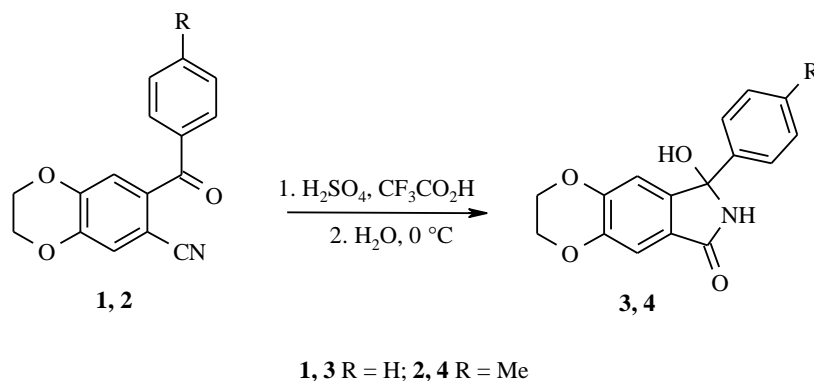


3-ГИДРОКСИФТАЛИМИДИНЫ ИЗ *o*-ЦИАНОБЕНЗОФЕНОНОВ

Ключевые слова: 3-гидрокси-5,6-этилендиоксифталимидины, 2-циано-4,5-этилендиоксибензофеноны.

3-Гидроксифталимидины относятся к весьма труднодоступному классу гетероциклических соединений. Вместе с тем, как структуры, содержащие в своем составе γ -лактамыный цикл, они представляют интерес не только как объекты биологических исследований, но и как исходные вещества для синтеза потенциальных лекарственных средств [1]. До сих пор отдельные представители 3-гидроксифталимидинов были получены лишь обходными путями [2–4], а прямого метода синтеза соединений этого класса не существовало.

Изучая гидролиз 2-циано-4,5-этилендиоксибензофенонов **1**, **2** под действием смеси серной и трифторуксусной кислот, мы неожиданно обнаружили, что они с высоким выходом непосредственно превращаются в соответствующие 3-гидроксифталимидины **3**, **4**.



Строение впервые полученных 3-гидроксифталимидинов **3**, **4** подтверждено данными ЯМР ^1H и масс-спектров, а структура соединения **3** установлена также методом РСА*.

В настоящее время выясняется, может ли найденное превращение использоваться в качестве общего метода получения 3-гидроксифтал- имидинов.

Спектры ЯМР ^1H снимали на приборе Bruker ORX-500 (500 МГц) в DMSO-d_6 , внутренний стандарт ТМС. Масс-спектр получен на приборе Finnigan MAT INCOS 50.

3-Гидрокси-3-фенил-5,6-этилендиоксифталиимидин (3). Раствор 1.00 г (3.8 ммоль) 2-циано-4,5-этилендиоксибензофенона (**1**) в смеси 1 мл (1.8 г) конц. H_2SO_4 и 4 мл (4.7 г) $\text{CF}_3\text{CO}_2\text{H}$ кипятят при перемешивании 5 ч, реакци- онную смесь выливают в 75 мл смеси воды со льдом (1:1). Выпавший осадок отфильтровывают, промывают водой до нейтральной реакции и перекристал- лизовывают из ацетона. Т. пл. 212–213 °С. Получают 0.88 г (82%) соединения **3**. Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 4.24 (4H, с, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$); 6.70 (1H, с, H-4); 6.80 (1H, с, OH); 7.05 (1H, с, H-7); 7.27 (1H, т, $J = 7.2$, H-4'); 7.33 (2H, т, $J = 7.2$, H-3',5'); 7.45 (2H, д, $J = 7.4$, ArH); 9.07 (1H, с, NH). Масс-спектр (ЭУ, 70 эВ), m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 283 $[\text{M}]^+$ (7); 265 (100); 237 (49); 223 (42); 206 (18); 209 (15); 188 (25); 181 (16); 162 (70); 153 (21); 149 (7); 134 (92); 119 (10); 105 (21); 77 (28); 62 (12); 58 (8); 50 (80); 43 (36); 39 (8). Найдено, %: С 67.55; Н 4.41; N 4.72. $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{NO}_4$. Вычислено, %: С 67.84; Н 4.62; N 4.95.

3-Гидрокси-3-(*p*-толил)-5,6-этилендиоксифталиимидин (4) получают анало- гично из 1.00 г (3.6 ммоль) 2-циано-4,5-этилендиокси-4'-метилбензофенона, выход 0.92 г (86%). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 2.27 (3H, с, CH_3); 4.24 (4H, с, $\text{OCH}_2\text{C H}_2\text{O}$);

* Данные РСА 3-гидрокси-3-фенил-5,6-этилендиоксифталиимидина (**3**) будут опубликованы в журнале *Acta Crystallografica* (Sec. E) в 2008 г.

6.68 (1H, с, H-4); 6.72 (1H, с, OH); 7.03 (1H, с, H-7); 7.13 (2H, д, $J = 7.9$) и 7.32 (2H, д, $J = 7.9$, ArH); 9.00 (1H, с, NH). Масс-спектр (ЭУ, 70 эВ), m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 297 $[\text{M}]^+$ (19); 279 (100); 264 (78); 251 (35); 237 (47); 223 (11); 206 (35); 195 (14); 188 (40); 162 (52); 139 (10); 134 (75); 119 (66); 104 (9); 91 (25); 78 (21); 65 (15); 50 (58); 39 (12). Найдено, %: С 68.18; Н 5.14; N 4.54. $\text{C}_{17}\text{H}_{15}\text{NO}_4$. Вычислено, %: С 68.67; Н 5.09; N 4.71.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. A. Eschenmoser, *Pure Appl. Chem.*, **7**, 297 (1963).
2. R. R. Schmidt, E. Schlipf, *Chem. Ber.*, **103**, 3783 (1970).
3. F. A. Golec, J. Auerbach, US Pat. 4331600; <http://www.espacenet.com>.
4. W. J. Houlihan; J. Nadelson, US Pat. 3959269; <http://www.espacenet.com>.

С. С. Мочалов, М. И. Хасанов

*Московский государственный университет
им. М. В. Ломоносова, Москва 119992, Россия
e-mail: ssmoch@org.chem.msu.ru*

Поступило 16.01.2008

ХГС. – 2008. – № 2. – С. 294