

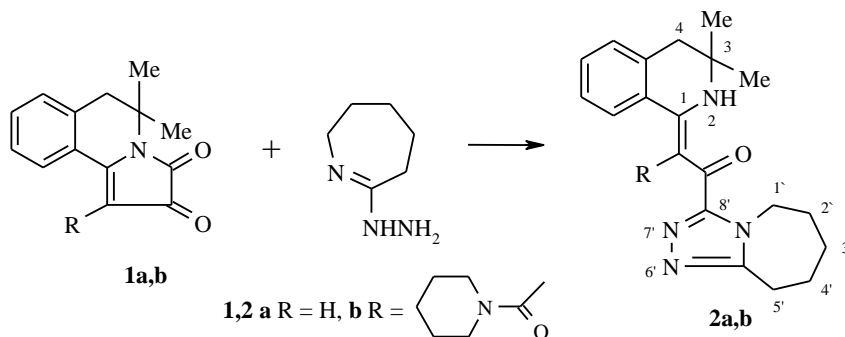
ГЕТЕРОЦИКЛИЗАЦИЯ ГИДРАЗИДИНА КАПРОЛАКТАМА ДЕЙСТВИЕМ 2,3-ДИОКСОПИРРОЛО[2,1-*a*]ИЗОХИНОЛИНОВ

Ключевые слова: 2-гидразино-3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепин, 2,3-диоксопирроло[2,1-*a*]изохинолины, 3,3-диметил-1-(1,2,4-триазоло[4,5-*a*]азепан-8-карбонил- метилидено)-1,2,3,4-тетрагидроизохинолины, раскрытие диоксопирролинового цикла.

Ранее было показано, что реакции 2,3-диоксопирроло[2,1-*a*]изохинолинов с некоторыми бинуклеофилами могут протекать с расщеплением лактамной связи и одновременной гетероциклизацией [1, 2]. Реакции этих соединений с циклическими гидразидами до настоящего времени неизвестны. Продолжая исследования химических свойств этих веществ, мы обнаружили, что диоксопирролины **1a,b** при небольшом нагревании в бензоле легко раскрывают пирролиновый цикл с образованием енамино- кетонов **2a,b**.

С помощью данного метода можно синтезировать разнообразные по структуре потенциально биологически активные соединения. В случае R = H полученные соединения представляют собой енаминокетоны, способные к дальнейшим превращениям.

Спектры ЯМР ^1H зарегистрированы на приборе Bruker-300 (300 МГц) в CDCl_3 , внутренний стандарт ГМДС. ИК спектры записаны на спектрометре Spesord M-80 в вазелиновом масле, масс-спектры – на приборе МАТ-311 (70 эВ, ЭУ).



3,3-Диметил-1-(1,2,4-триазоло[4,5-*a*]азепан-8-илкарбонилметилено)-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин (2a). К раствору 2.27 г (10 ммоль) соединения **1a** в 20 мл бензола добавляют 1.91 г (15 ммоль) 2-гидразино-3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепина (гидразида капролактама) [3]. При нагревании до 60–70 °С окрашенная в красный цвет смесь мгновенно обесцвечивается. При разбавлении 50 мл гексана выпадает желтый осадок, который отфильтровывают, сушат и перекристаллизовывают из гексана. Выход 2.71 г (80%). ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1630 ($\text{C}=\text{O}$) и 3150 (NH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 1.24 (6H, с, 2CH_3); 1.28–1.81 (6H, м, H-2',3',4'); 2.39–2.53 (2H, м, H-5'); 2.86 (2H, с, H-4); 3.09–3.23 (2H, м, H-1'); 6.72 (1H, с, $=\text{CHCO}$); 7.14–7.30 (4H, м, Ar); 12.45 (1H, с, NH). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 336.4 [M^+] (33); 321 [M^+-CH_3] (10), 200 [$\text{M}^+-(1,2,4\text{-триазоло}[4,5\text{-}a]\text{азепан})$] (63). Найдено, %: C 71.3; H 7.1; N 16.8. $\text{C}_{20}\text{H}_{24}\text{N}_4\text{O}$. Вычислено, %: C 71.4; H 7.2; N 16.7.

N,N-Пентаметиленамид 3-оксо-3-(1,2,4-триазоло[4,5-*a*]азепан-8-ил)-2-(3,3-диметил-1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-1-иден)пропановой кислоты (2b) получают аналогично из 3.38 г (10 ммоль) соединения **1b**, выход 3.80 г (85%). Т. пл. 93–94 °С. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1635, 1670 ($\text{C}=\text{O}$) и 3120 (NH). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 1.25 (6H, с, 2CH_3); 1.36–1.93 (6H, м, $3\text{CH}_2\text{-C}$ азепана и 6H, м, $3\text{CH}_2\text{-C}$ пиперидина); 2.40–2.55 (2H, м, H-5'); 3.15–3.80 (2H, м, $\text{CH}_2\text{-N}$ азепана и 4H, м, $2\text{CH}_2\text{N}$ пиперидина); 2.83 (2H, с, H-4); 7.01–7.62 (4H, м, Ar); 12.20 (1H, с, NH). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 447.6 [M^+] (13); 335 [$\text{M}^+-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2)_5$] (33). Найдено, %: C 69.7; H 7.3; N 15.7. $\text{C}_{26}\text{H}_{33}\text{N}_5\text{O}_2$. Вычислено, %: C 69.8; H 7.4; N 15.6.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. N. N. Polygalova, A. G. Mikhailovskii, M. I. Vakhnin, in *Nitrogen-containing Heterocycles*, V. G. Kartsev (Ed.), ICSPF, Moscow, 2006, vol. 1, p. 402.
2. О. В. Сурикова, А. Г. Михайловский, Н. Н. Полыгалова, П. Г. Нейфельд, М. И. Вахнин, *ЖОрХ*, **43**, 1416 (2007).
3. М. В. Рубцов, А. Г. Байчиков, *Синтетические химико-фармацевтические препараты*, Медицина, Москва,

1971, с. 178.

О. В. Сурикова, А. Г. Михайловский, М. И. Вахрин

*Пермская государственная фармацевтическая
академия, Пермь 614990, Россия
e-mail: perm@pfa.ru*

Поступило 24.12.2007

ХГС. – 2008. – № 2 – С. 298