

СИНТЕЗ, НЕКОТОРЫЕ ПРЕВРАЩЕНИЯ И ПРОТИВОСУДОРОЖНАЯ АКТИВНОСТЬ ПРОИЗВОДНЫХ 3-ОКСОТИОПИРАНО/3,4-с/ПИРИДИНОВ

Е. Г. ПАРОНИКЯН, С. Н. СИРАКАНЯН, А. С. НОРАВЯН и Дж. А. МЕЛКОЧЯН

Институт тонкой органической химии им. А. Л. Минджояна
АН Республики Армения, Ереван

Поступило 15 X 1990

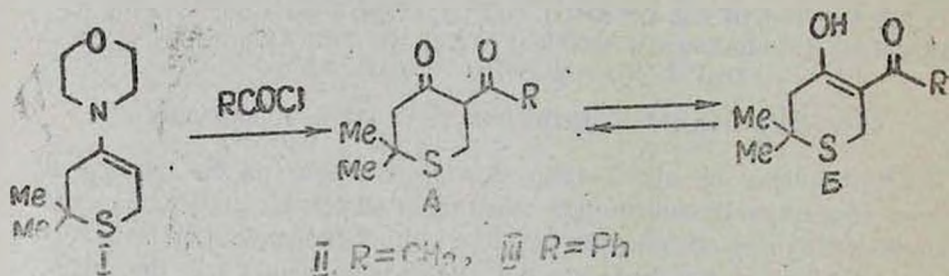
На базе 2,2-диметилтетрагидротиюпиран-4-она разработан метод синтеза производных 3-оксотиюпирано/3,4-с/пиридинов, проведены некоторые их превращения. Изучена противосудорожная активность синтезированных соединений.

Библ. ссылок 6.

В последние годы значительно возрос интерес к изысканию биологически активных соединений в ряду конденсированных пиридинов [1, 2]

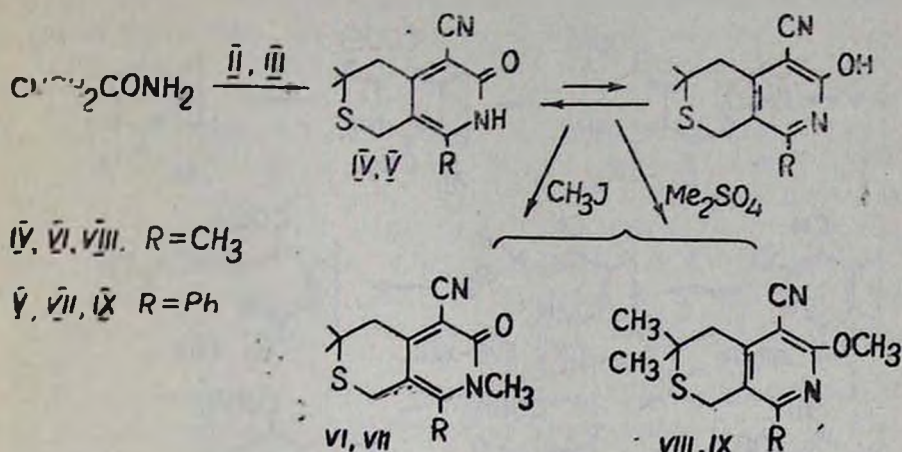
Ранее нами были получены производные 1-оксо(тио)тиопирано/3,4-с/пиридинов [3, 4]. В настоящей работе разработан метод получения 3-оксотиюпирано/3,4-с/пиридинов, синтезированы некоторые их производные.

Синтез основан на взаимодействии 2,2-диметил-4-(N-морфолино)-2,3-дигидро-6Н-тиопирана (I) с хлорангидридами кислот. В результате реакции выделены соответствующие α -ацилтиопиран-4-оны II, III.



Изучение ПМР спектров соединений II и III показало, что в растворах (CDCl₃, CCl₄) соединение II существует в таутомерной форме Б (об этом свидетельствуют триплетные сигналы метиленовых групп в области 2,45 и 3,4 м. д.), тогда как соединение III—в смеси двух таутомерных форм (А и Б). ПМР спектр соединения III довольно сложен для интерпретации. Однако наличие в спектре двух дублетов в области 4,58 (J=5 Гц) и 4,7 м. д. (J=5 Гц), характерных для протона у углерода 5-ого положения кольца (а-а, а-е взаимодействие) (форма А), помимо двух триплетных сигналов метиленовых групп (положении 3 и 6 кольца) в области 2,35 и 3,64 м. д. (форма Б), доказывает существование в растворе смеси двух таутомерных форм (А и Б).

Конденсацией α -ацилтиопиран-4-онов II, III с цианацетамидом синтезированы 3-оксотиопирано/3,4-с/пиридины IV, V. Данные ИК спектров соединений IV, V показывают, что они существуют в лактамной таутомерной форме, однако их метилирование протекает по обоим реакционным центрам.



Соотношение метилированных продуктов в основном зависит от электронных эффектов заместителей в положении 1 кольца и характера метилирующих агентов (йодистый метил и диметилсульфат). Данные ПМР исследования показали, что при метилировании соединения IV йодистым метилом исключительно получается N-метилированный продукт (соединение IV), в случае же диметилсульфата—образуется смесь N- и O-метилированных изомеров (VI и VIII) в соотношении 5:2. При $R = \text{C}_6\text{H}_5$ с обоими метилирующими агентами, в отличие от метилирования 3-оксопирано/3,4-с/пиридинов, образуется смесь продуктов с преобладанием O-метилированного изомера IX. Соотношение изомеров VII и IX при метилировании йодистым метилом составляет 1:2, диметилсульфатом—2:3.

При сопоставлении данных метилирования 3-оксопирано/3,4-с/пиридинов [5] и 3-оксотиопирано/3,4-с/пиридинов видно, что на соотношение продуктов метилирования влияет также характер гетероатома конденсированного с пиридином цикла.

С целью изучения биологических свойств на основе синтезированных 3-оксотиопирано/3,4-с/пиридинов получен ряд производных за счет изменения функции в положениях 3 и 4 кольца. Так, омылением оксонитрила IV 25% водным раствором гидроксида натрия получена оксокислота X, которая затем превращена в соответствующий эфир XI и гидразид XII. Хлорированием оксонитрилов IV и V хлорокисью фосфора синтезированы хлорпроизводные XIII, XIV. Соединение XIII под действием метилата натрия превращено в 3-метоксипроизводное VIII. Омылением XIII 3% водным раствором гидроксида калия получен оксоамид XV. При гидролизе XIII в присутствии перекиси водорода происходит как превращение нитрильной группы в амидную (XVI), так и одновременное окисление атома серы

S 17,22. Соединение III: выход 75%, т. кип. 150°/2 мм. ИК спектр, ν , см^{-1} : 1600 ($\text{C}=\text{C}$), 1670 (CO), 1700 (CO), 3300—3600 (OH). Найдено, %: C 67,66; H 6,41; S 19,79. $\text{C}_{14}\text{H}_{16}\text{O}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 67,72; H 6,49; S 19,91.

1-Замещенные-6,6-диметил-5,6-дигидро-3-оксо-4-циан-8H-тиопирано-3,4-с/пиридины (IV, V) получены аналогично [6]. Соединение IV: выход 65%, т. пл. 249—250°. R_f 0,51 (гептан—этанол—хлороформ, 1:2:3). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1590 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 1640 (CO), 2230 (CN). Спектр ПМР (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 3,6 т (2H, CH_2S); 2,9 т (2H, CH_2), 2,31 с (3H, CH_3); 1,3 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 61,49; H 6,14; N 12,20; S 13,99. $\text{C}_{12}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{OS}$. Вычислено, %: C 61,52; H 6,02; N 11,95; S 13,69. Соединение V: выход 55%, т. пл. 292—293°. R_f 0,78 (пиридин—этанол, 1:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 1660 (CO), 2220 (CN). Спектр ПМР (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 7,4 с (C_6H_5); 3,38 т (2H, CH_2S); 2,93 т (2H, CH_2); 1,3 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 68,71; H 5,38; N 9,36; S 10,65. $\text{C}_{17}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{OS}$. Вычислено, %: C 68,90; H 5,44; N 9,45; S 10,79.

5,6-Дигидро-3-оксо-1,2,6,6-тетраметил-4-циан-8H-тиопирано-3,4-с/пиридин (VI). К смеси 1,2 г (0,005 моля) соединения IV, 5 мл 10% водного раствора гидроокиси калия и 160 мл ацетона при перемешивании прибавляют по каплям 24 г (0,16 моля) йодистого метила. Смесь кипятят при перемешивании 2 ч. После охлаждения отгоняют растворитель, остаток кристаллизуют этанолом. Получают 0,78 г (63,3%) соединения VI, т. пл. 178—180°. R_f 0,75 (хлороформ—эфир, 3:2). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1620 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 1680 (CO), 2240 (CN). Спектр ПМР (пиридин- d_5), δ , м. д.: 3,66 т (2H, CH_2S); 3,5 с (3H, N- CH_3); 3,0 т (2H, CH_2); 2,23 с (3H, CH_3), 1,3 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 62,74; N 11,17; H 6,41; S 12,74. $\text{C}_{13}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{OS}$. Вычислено, %: C 62,89; H 6,49; N 11,27; S 12,89.

Аналогично проведено метилирование соединения V. Получена смесь N-метилированного (VII) и O-метилированного (IX) продуктов с общим выходом 64,5%. Анализ с помощью ТСХ подтверждает наличие двух веществ: R_f равны 0,66 и 0,84 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). Количественное соотношение N- и O-метилированных продуктов, определенное по интенсивности сигналов соответствующих метильных групп в ПМР спектрах, равно 1:2 для VII и IX.

Метилирование 3-оксо-тиопирано-3,4-с/пиридинов IV и V диметилсульфатом проведено аналогично [5]. Получена смесь N-метилированных (VI, VII) и O-метилированных (VIII, IX) продуктов с общими выходами VI и VIII—66%, VII и IX—53%. R_f 0,75 и 0,83 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5) для VI и VIII; 0,52 и 0,73 (этилацетат—хлороформ, 3:1) для VII и IX. Количественное соотношение N и O-метилированных продуктов, определенное по интенсивности сигналов соответствующих метильных групп в ПМР спектрах, равно 5:2 для VI и VIII, 2:3 для VII и IX.

5,6-Дигидро-4-карбокси-3-оксо-1,6,6-триметил-8H-тиопирано-3,4-с/пиридин (X). Смесь 1,2 г (0,005 моля) соединения IV и 20 мл 25% водного раствора гидроокиси натрия кипятят 40 ч с обратным холо-

дильником. После охлаждения смесь подкисляют конц. раствором хлористоводородной кислоты и экстрагируют дважды хлороформом (50 мл). Отгоняют хлороформ и получают 0,55 г (44%), соединения X, т. пл. 223—224° (этанол). R_f 0,67 (пиридин—этанол, 1:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 1630 (CO амид.), 1710 (CO кисл.), 3260—3320 (NH , OH). Спектр, ПМР ($\text{DMCO}-d_6$), δ , м. д.: 3,58 т (2H, CH_2S); 3,5 т (2H, CH_2); 2,33 с (3H, CH_3); 1,23 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 56,75; H 5,78; N 5,48; S 12,48. $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{NO}_3\text{S}$. Вычислено, %: C 56,91; H 5,97; N 5,53; S 12,63.

5,6-Дигидро-3-оксо-1,6,6-триметил-4-этоксикарбонил-8H-тиопиранол-3,4-с/пиридин (XI). Смесь 1,3 г (0,005 моля) оксокислоты X, 25 мл этанола, 0,2 мл конц. серной кислоты, 20 мл бензола кипятят с обратным холодильником 48 ч. Отгоняют растворители досуха, добавляют 20 мл воды и отфильтровывают выпавшие кристаллы. Получают 1,1 г (75,7%) соединения XI, т. пл. 174—175° (этанол). R_f 0,71 (этанол—вода, 2:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1560 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 1620 (CO амид.), 1720 (CO). Спектр, ПМР ($\text{DMCO}-d_6$), δ , м. д.: 4,2 к (2H, CH_2CH_3 , $J=7$ Гц); 3,66 т (2H, CH_2S); 3,58 т (2H, CH_2); 2,43 с (3H, CH_3); 1,15—1,38 м (9H, 3CH_3). Найдено, %: C 59,65; H 6,75; N 4,88; S 11,29. $\text{C}_{14}\text{H}_{23}\text{O}_3\text{NS}$. Вычислено, %: C 59,79; H 6,81; N 4,98; S 11,37.

5,6-Дигидро-4-карбазоил-3-оксо-1,6,6-триметил-8H-тиопиранол-3,4-с/пиридин (XII). К раствору 1,4 г (0,005 моля) оксоэфира XI в 15 мл этанола прибавляют 2 мл гидразингидрата и кипятят с обратным холодильником 4 ч. После охлаждения выпавшие кристаллы отфильтровывают, промывают водой. Получают 1 г (70%) соединения XII, т. пл. 246—247° (этанол). R_f 0,82 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:4:5). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1620 (CO амид.), 1650 (CO гид.), 3260—3300 (NHNH_2). Найдено, %: C 53,87; H 6,36; N 15,58; S 11,84. $\text{C}_{12}\text{H}_{17}\text{N}_3\text{O}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 53,92; H 6,41; N 15,72; S 11,97.

5,6-Дигидро-1,6,6-триметил-3-хлор-4-циан-8H-тиопиранол-3,4-с/пиридин (XIII). Смесь 2,34 г (0,01 моля) соединения IV и 25 мл хлорокиси фосфора кипятят с обратным холодильником 3 ч. Отгоняют избыток хлорокиси фосфора досуха, к остатку при охлаждении ледяной водой и перемешивании прибавляют 20 мл 10% гидроокиси калия. Образовавшиеся кристаллы отфильтровывают, промывают водой. Получают 2,5 г (98,1%) соединения XIII, т. пл. 114—115° (метанол). R_f 0,59 (этанол—эфир, 1:8). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар.); 2230 (CN). Спектр ПМР (CDCl_3), δ , м. д.: 3,68 т (2H, CH_2S), 3,0 т (2H, CH_2); 2,53 с (3H, CH_3), 1,31 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 56,82; H 5,14; N 10,93; Cl 13,90. $\text{C}_{12}\text{H}_{13}\text{N}_2\text{SCl}$. Вычислено, %: C 56,97; H 5,18; N 11,07; Cl 14,04.

Аналогично получен хлорнитрил XIV. Выход 84,6%, т. пл. 139—140° (метанол). R_f 0,61 (этанол—эфир, 1:4). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1570 ($\text{C}=\text{C}$ ар.), 2240 (CN). Спектр ПМР (CDCl_3), δ , м. д.: 7,43 с (5H, C_6H_5); 3,71 т (2H, CH_2S); 3,05 т (2H, CH_2); 1,4 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 64,77; H 4,75; N 8,84; Cl 11,14. $\text{C}_{17}\text{H}_{19}\text{N}_2\text{SCl}$. Вычислено, %: C 64,71; H 4,81; N 8,91; Cl 11,27.

5,6-Дигидро-3-метокси-1,6,6-триметил-4-циан-8Н-тиопирано/3,4-с/пиридин (VIII) получен аналогично [5]. Выход 67,5%, т. пл. 83—84° (метанол). R_f 0,76 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 2230 (CN). Спектр ПМР (пиридин- d_6), δ , м. д.: 3,98 с (3H, OCH_3); 3,56 т (2H, CH_2S); 3,1 т (2H, CH_2); 2,43 с (3H, CH_3); 1,31 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 54,11; H 6,07; N 10,34; S 11,88. $\text{C}_{12}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{OS}$. Вычислено, %: C 54,07; H 6,04; N 10,50; S 11,99.

5,6-Дигидро-3-оксо-4-карбамоил-1,6,6-триметил-8Н-тиопирано/3,4-с/пиридин (XV). Смесь 2,5 г (0,01 моля) хлорнитрила XIII и 50 мл 7% водного раствора гидроокиси калия и 20 мл диоксана кипятят с обратным холодильником 28 ч. Отгоняют растворитель, добавляют 18% раствор хлористоводородной кислоты до нейтральной реакции, выпавшие кристаллы отфильтровывают. Получают 1 г (39,6%) соединения XV, т. пл. 196—197° (этанол). R_f 0,71 (этилацетат—хлороформ, 2:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1570 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 1620 (CO), 1670 (CONH_2), 3160, 3340 (NH_2). Спектр ПМР (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 7,75 и 8,01 сс (по 1H, NH_2); 3,88 т (2H, CH_2S); 2,86 т (2H, CH_2); 2,53 с (3H, CH_3); 1,35 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 57,07; H 6,27; N 11,12; S 12,54. $\text{C}_{12}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 57,13; H 6,39; N 11,10; S 12,68.

5,6-Дигидро-4-карбамоил-1,6,6-триметил-3-хлор-8Н-тиопирано/3,4-с/пиридин (XVI) получен аналогично [5]. Выход 36%, т. пл. 265—266° (этанол). R_f 0,51 (хлороформ—этанол, 3:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1560 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 1670 (CO), 3150, 3300 (NH_2). Спектр ПМР (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 7,8 и 8,06 сс (по 1H, NH_2); 4,63 т (2H, CH_2S); 3,36 т (2H, CH_2); 2,23 с (3H, CH_3); 1,43 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 53,17; H 5,49; N 10,27; Cl 13,07. $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{N}_2\text{OSCl}$. Вычислено, %: C 53,23; H 5,58; N 10,34; Cl 13,11.

Аналогично получено соединение XVII, только взаимодействие проведено при кипячении в течение 20 ч. Выход 35%, т. пл. 303—304° (ДМСО). R_f 0,75 (пиридин—этанол, 1:1). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1360 (SO_2), 1560 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 1670 (CO), 3130, 3300 (NH_2). $M=302$ (масс-спектрометрически). Найдено, %: C 47,54; H 4,84; N 9,17; S 10,51. $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{N}_2\text{O}_3\text{SCl}$. Вычислено, %: C 47,60; H 4,99; N 9,25; S 10,56.

3-Амино-5,6-дигидро-1,6,6-триметил-4-циан-8Н-тиопирано/3,4-с/пиридин (XVIII) получен аналогично [5]. Выход 96%, т. пл. 178—179° (пирометан). R_f 0,81 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 1660 (NH_2 деф.), 2230 (CN), 3155, 3320, 3380 (NH_2). Спектр ПМР (ДМСО- d_6), δ , м. д.: 6,33 с (2H, NH_2); 3,58 т (2H, CH_2S); 2,73 т (2H, CH_2); 2,2 с (3H, CH_3); 1,16 с (6H, 2CH_3). Найдено, %: C 61,74; H 6,41; N 18,11. $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{N}_2\text{S}$. Вычислено, %: C 61,78; H 6,48; N 18,01.

3-Бензиламино-5,6-дигидро-1,6,6-триметил-4-циан-8Н-тиопирано/3,4-с/пиридин (XIX) получен аналогично [5]. Выход 72,3%, т. пл. 175—176° (этанол). R_f 0,51 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см^{-1} : 1580 ($\text{C}=\text{C}$ ар), 2220 (CN), 3360 (NH). Спектр ПМР (пиридин- d_6), δ , м. д.: 7,26—7,63 м (5H, C_6H_5), 4,83—4,93 м (2H, $\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$), 3,53 т (2H, CH_2S), 2,9 т (2H, CH_2), 2,2 с (3H, CH_3), 1,15 с

(6H, 2CH₃). Найдено, %: С 70,44; Н 6,41; N 12,87. C₁₆H₂₁N₃S. Вычислено, %: С 70,56; Н 6,54; N 12,99.

Аналогично получено соединение XXI. Выход 82,2%, т. пл. 89—90° (этанол). R_f 0,69 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1560 (C=C ар), 2220 (CN). Спектр ПМР (ДМСО—d₆), δ , м. д.: 2,06—2,43 м (12H, 6CH₂); 1,6 с (3H, CH₃); 1,1 с (6H, 2CH₃). Найдено, %: С 63,21; Н 6,81; N 13,64; S 10,41. C₁₆H₂₁N₃OS. Вычислено, %: С 63,34; Н 6,97; N 13,85; S 10,54.

3-Бензилметиламино-5,6-дигидро-1,6,6-триметил-4-циан-8H-тиопирано[3,4-с]пиридин (XX). Смесь 1,25 г (0,005 моля) хлорнитрила XIII, 7 мл метилбензиламина и 5 мл n-бутанола кипятят с обратным холодильником в течение 10 ч. После охлаждения образовавшиеся кристаллы отфильтровывают, промывают водой и этанолом. Получают 1,1 г (65,5%) соединения XX, т. пл. 152—153° (этанол). R_f 0,63 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1560 (C=C ар), 2220 (CN). Спектр ПМР (пиридин—d₅), δ , м. д.: 7,26—7,46 м (5H, C₆H₅); 4,9 с (2H, CH₂N); 3,66 т (2H, CH₂S); 3,2 с (3H, CH₃N); 3,05 т (2H, CH₂); 2,33 с (3H, CH₃); 1,3 с (6H, 2CH₃). Найдено, %: С 71,09; Н 6,58; N 12,38; S 9,34. C₂₀H₂₃N₃S. Вычислено, %: С 71,19; Н 6,87; N 12,45; S 9,49.

Аналогично получено соединение XXII. Выход 74,9%, т. пл. 90—91° (этанол). R_f 0,71 (бутанол—уксусная кислота—вода, 4:2:5). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1550 (C=C ар), 2220 (CN). Спектр ПМР (СДCl₃), δ , м. д.: 3,43—3,66 м (6H, 3CH₂); 2,91 т (2H, CH₂); 2,4 с (3H, CH₃); 1,6—1,8 м (6H, 3CH₂); 1,36 с (6H, 2CH₃). Найдено, %: С 67,58; Н 7,69; N 13,86; S 10,47. C₁₇H₂₃N₃S. Вычислено, %: С 67,74; Н 7,69; N 13,94; S 10,61.

3-Бензиламино-5,6-дигидро-4-карбамоил-1,6,6-триметил-8H-тиопирано[3,4-с]пиридин (XXIII) получен аналогично [5]. Выход 58,3%, т. пл. 185—186° (этанол). R_f 0,8 (пиридин—этанол, 1:1). ИК спектр, ν , см⁻¹: 1580 (C=C ар), 1670 (CO), 3150, 3360, 3430 (NH, NH₂). Спектр ПМР (ДМСО—d₆), δ , м. д.: 7,45 и 7,75 сс (по 1H, NH₂); 7,1—7,3 м (5H, C₆H₅); 5,93 т (1H, NH); 4,48 д (2H, CH₂N, J=6 Гц); 3,6 т (2H, CH₂S); 2,7 т (2H, CH₂); 2,23 с (3H, CH₃); 1,2 с (6H, 2CH₃). Найдено, %: С 66,71; Н 6,58; N 12,28; S 9,46. Вычислено, %: С 66,85; Н 6,79; N 12,31; S 9,37.

3-ՕՔՍՈԹԻՈՊԻՐԱՆՈ (3,4-С) ՊԻՐԻԴԻՆՆԵՐԻ ԱՇԱՆՑՑԱԼՆԵՐԻ ՍԻՆԹԵԶԸ,
ՌԸՂՇ ՓՈԽԱՐԿՈՒՄՆԵՐԸ ԵՎ ՀԱԿԱՑՆՑՈՒՄԱՅԻՆ ԱԿՏԻՎՈՒԹՅՈՒՆԸ

Բ. Գ. ՊԱՐՈՆԻԿՅԱՆ, Ս. Ն. ՍԻՐԱԿԱՆՑԱՆ, Ա. Ս. ՆՈՐԱԿՅԱՆ Ե Զ. Ա. ՄԵԼԻՔՈՆՅԱՆ

2,2-Դիմեթիլտետրահիդրոթիոպիրան-4-օնի հիման վրա մշակված է 3-օքսաթիոպիրանո[3,4-с]պիրիդինների ածանցյալների ստացման եղանակ, կատարված են դրանց որոշ փոխարկումները, Ուսումնասիրված է տիմոկեզված միացությունների հակացնցողային ակտիվությունը:

SYNTHESIS, TRANSFORMATIONS AND ANTICONVULSANT ACTIVITY OF 3-OXOTHIOPYRANO/3,4-c PYRIDINE DERIVATIVES

Ye. G. PARONIKIAN, S. N. SIRAKANIAN, A. S. NORAVIAN and J. A. MELKONIAN

A method for synthesis of 3-oxothiopyrano/3,4-c/pyridine derivatives from 2,2-dimethyltetrahydrothiopyran-4-one has been elaborated.. The resulting compounds have been subjected to some transformations. The anticonvulsant activity of the synthesized compounds has been studied.

Л И Т Е Р А Т У Р А

1. Gills P. M., Haemers A., Pattin P. R. — Antimicrob. Agents Chemother., 1978, v. 13, p. 533.
2. Tamura Y., Chen L. C., Fujita M., Kita Y. — Chem. pharm. Bull., 1982, v. 30, p. 1257.
3. Пароникян Е. Г., Мирзоян Г. В., Норавян А. С., Вартамян С. А. — ХГС, 1987, № 7, с. 989.
4. Пароникян Е. Г., Норавян А. С., Вартамян С. А. — Арм. хим. ж., 1987, т. 40, № 9, с. 587.
5. Пароникян Е. Г., Сиракян С. Н., Норавян А. С., Пароникян Р. Г. — Арм. хим. ж., 1989, т. 42, № 12, с. 766.
6. Пароникян Е. Г., Сиракян С. Н., Линдеман С. В., Алексанян М. С., Карапетян А. А., Норавян А. С., Стручков Ю. Т. — ХГС, 1989, № 8, с. 1137.

Армянский химический журнал, т. 44, № 4, стр. 257—259 (1991 г.)

КРАТКИЕ СООБЩЕНИЯ

УДК 547.724

ИССЛЕДОВАНИЯ В ОБЛАСТИ НЕНАСЫЩЕННЫХ ЛАКТОНОВ. СИНТЕЗ 3-ЦИАНО-4-ДИБРОММЕТИЛ-5,5-ДИМЕТИЛ- Δ^3 -БУТЕНОЛИДА

А. А. АВETИСЯН, А. А. АХНАЗАРЯН и Г. С. МЕЛИКЯН

Ереванский государственный университет

Поступило 27 XII 1990

В синтезе природных соединений и их аналогов, содержащих в структуре бутенолидный цикл, успешно используются галогенометил-замещенные ненасыщенные γ -лактоны, способы получения которых в основном сводятся к циклизации различных галогенпроизводных линейного строения [1]. Определенный интерес представляет непосредственное галогенирование лактонов.

Ранее было показано, что бромирование 3-карбэтокси-4,5,5-триметил- Δ^3 -бутенолида приводит к образованию 3-карбэтокси-4-бромметил-5,5-диметил- Δ^3 -бутенолида [2]. Однако аналогичная реакция не имела места в случае 3-циано-4,5,5-триметил- Δ^3 -бутенолида (I) [3]. При бромировании N-бромсукцинимидом или молекулярным бромом