

**СИНТЕЗ И ПРЕВРАЩЕНИЯ (3,3-ДИМЕТИЛ-2-ЦИАНО-3,4-
ДИГИДРОНАФТАЛИН-1-ИЛ)ФЕНИЛКАРБАМАТА**

**А. И. МАРКОСЯН, К. К. АЙРАПЕТЯН, С. А. ГАБРИЕЛЯН, С. С. МАМЯН,
Дж. А. АВАКИМЯН и Г. М. СТЕПАНЯН**

Научно-технологический центр органической и фармацевтической химии НАН
Республики Армения
Армения, 0014, Ереван, пр. Азатутян, 26
Тел: (37410)288443, E-mail: ashot@markosyan.am

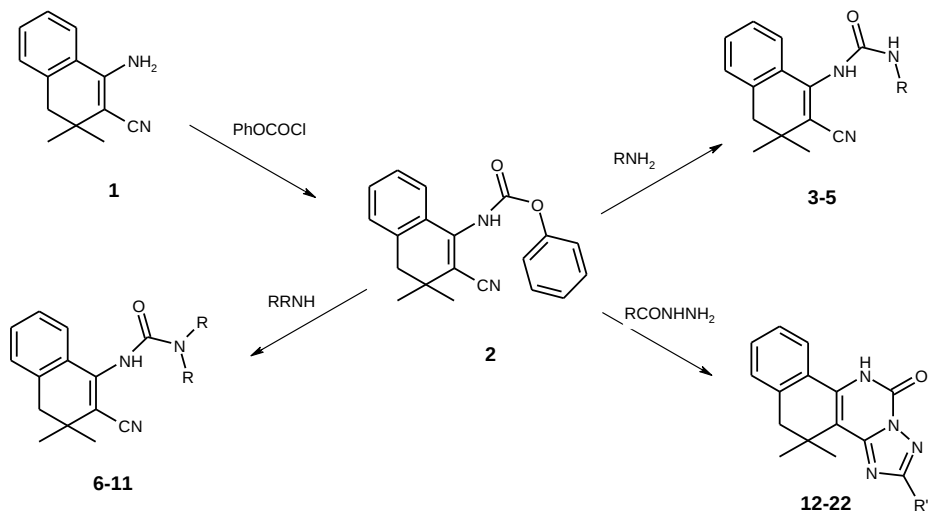
Поступило 27 III 2018

Конденсацией 1-амино-3,3-диметил-3,4-дигидронафталин-2-карбонитрила с фенилхлорформиа́том синтезирован (3,3-диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)фенилкарбамат, образующий с первичными и вторичными аминами дизамещённые и тризамещённые мочевины, соответственно. Показано, что тот же карбамат реагирует с гидразидами ароматических, алкоксиароматических и гетероциклических кислот с образованием 2-замещённых 4,4-диметил-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-онов. Согласно результатам биологических исследований, большинство исследованных соединений проявляет слабую или умеренную антибактериальную активность в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов.

Библ. ссылок 21.

В последнее время интерес к химии бензо[h]хиназолиновых соединений значительно возрос, что обусловлено их ценными биологическими свойствами[1-7]. Ранее проведенные нами исследования доказали, что для синтеза бензо[h]хиназолиновых соединений различного строения (в том числе и спироциклического) удобными синтонами могут служить соответствующие β-аминоэфиры и β-аминонитрилы [8-17]. С целью синтеза 2-замещённых 4,4-диметил-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-онов нами разработан метод получения исходного ключевого соединения — (3,3-диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)фенилкарбамата (2). Метод основан на взаимодействии 1-амино-3,3-диметил-3,4-дигидронафталин-2-карбонитрила (1) с фенилхлорформиа́том в среде бензола. Поскольку мочевины представляют оп-

ределённый интерес с биологической точки зрения, карбамат **2** введен во взаимодействие с первичными (пропиламин, изопропиламин и анилин) и вторичными (диметиламин, диэтиламин, пирролидин, пиперидин, морфолин и азепан) аминами, приведшее к образованию дизамещённых (**3-5**) и тризамещённых (**6-11**) мочевины дигидронафталинового ряда. Синтез целевых 2-замещённых 4,4-диметил-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-*c*]хиназолин-11(10Н)-онов осуществлен конденсацией карбамата **2** с гидразидами различных карбоновых кислот (изоникотиновой, бензойной, 4-бромбензойной, 4-этоксibenзойной, 4-бутоксibenзойной, 4-*изо*-бутоксibenзойной, фенилуксусной, 2-(*о*-толилоксиуксусной, 2-*м*-толил-оксиуксусной, 2-*п*-толилоксиуксусной) по схеме:



$\text{R} = \text{C}_3\text{H}_7$ (**3**), *изо*- C_3H_7 (**4**), C_6H_5 (**5**), CH_3 (**6**), C_2H_5 (**7**), пирролидино (**8**), пиперидино (**9**), морфолино (**10**), азепино (**11**), $\text{R}' = 4$ -пиридил (**12**), C_6H_5 (**13**), $\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$ (**14**), 4- BrC_6H_4 (**15**), 2- $\text{CH}_3\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_2$ (**16**), 3- $\text{CH}_3\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_2$ (**17**), 4- $\text{CH}_3\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_2$ (**18**), 2- $\text{ClC}_6\text{H}_4\text{OCH}_2$ (**19**), 4- $\text{C}_2\text{H}_5\text{OC}_6\text{H}_4$ (**20**), 4- $\text{C}_4\text{H}_9\text{OC}_6\text{H}_4$ (**21**), 4-*изо*- $\text{C}_4\text{H}_9\text{OC}_6\text{H}_4$ (**22**).

Изучены антибактериальные свойства синтезированных соединений по методу диффузии в агаре [21] при бактериальной нагрузке 20 млн микробных тел на 1 мл среды. В качестве тест-объектов использованы грамположительные стафилококки (*Staph. Aureus* 209p, 1) и грамотрицательные палочки (*Sh.dysenteriae* Flexneri 6858, *E. Coli* 0-55). Учёт результатов проведен по диаметру (*d*) зон отсутствия роста микроорганизмов на месте нанесения соединений (в мм). У большинства исследованных соединений выявлена слабая или умеренная активность в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов в зоне диаметром 10-16 мм.

Экспериментальная часть

ИК-спектры сняты на спектрофотометре "FT-IR NEXUS" в вазелиновом масле, спектры ЯМР ^1H и ^{13}C — на приборе Varian "Mercury-300", внутренний стандарт — ТМС или ГМДС. ТСХ проведена на пластинках "Sorbfil", проявитель — пары йода.

(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)фенилкарбамат (2). Смесь 19.8 г (0.1 моля) аминонитрила **1** и 15.7 г (0.1 моля) фенилхлорформиата в 100 мл бензола кипятят с обратным холодильником 7 ч. После отгонки растворителя остаток перекристаллизовывают из смеси этанол-вода (3:1). Получают 29 г (91%) карбамата **2**, т. пл. 172-173°C. R_f 0.65 (хлороформ-ацетон, 4:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1590, 1600 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1759 ($\text{C}=\text{O}$); 2204 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3400 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/ CCl_4 — 1/3), δ , м.д.: 1.25 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 2.85 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 7.14-7.24 (м, 4H_{аром.}), 7.27-7.42 (м, 4H_{аром.}), 7.49-7.55 (м, 1H_{аром.}), 9.82 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/ CCl_4 — 1/3), δ , м.д.: 26.02 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 32.58 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 41.56 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 114.53 ($\text{C}=\text{C}\text{-C}\equiv\text{N}$), 115.61 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 121.29 (2($\text{CH}_{\text{аром.}}$)), 124.32 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 124.67 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 126.40 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.88 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 128.61 (2($\text{CH}_{\text{аром.}}$)), 129.11 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 129.83 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 135.04 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 143.00 ($\text{C}=\text{C}\text{-C}\equiv\text{N}$), 150.61 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 151.59 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: C 75.45; H 5.70; N 8.80. $\text{C}_{20}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_2$. Вычислено, %: C 75.28; H 5.82; N 8.65.

Общая методика синтеза мочевин 3-11. Смесь 3.2 г (0.01 моля) карбамата **2**, 0.015 моля амина и 40 мл абсолютного этанола кипятят с обратным холодильником в течение 10 ч. Затем к реакционной смеси добавляют 10 мл воды. Образовавшиеся кристаллы отфильтровывают, несколько раз промывают водой и перекристаллизовывают из 60-80% этанола.

1-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)-3-пропилмочевина

(3). Выход 2 г (70%), т. пл. 159-160°C. R_f 0.63 (бензол-этилацетат, 4:3). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1611 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1639 ($\text{C}=\text{O}$); 2204 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3200-3360 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/ CCl_4 — 1/3), δ , м.д., Гц: 0.96 (т, $J=7.35$, 3H, NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 1.17 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 1.45-1.59 (м, 2H, NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 2.77 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 3.03-3.11 (м, 2H, NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 6.39 (т, $J=5.72$, 1H, NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 7.09-7.31 (м, 4H_{аром.}), 8.00 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/ CCl_4 — 1/3), δ , м.д.: 11.01 (NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 22.82 (NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 26.03 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 31.91 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 40.91 (NH- $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 41.95 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 107.57 ($\text{C}=\text{C}\text{-C}\equiv\text{N}$), 116.33 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 125.11 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 125.70 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.51 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.05 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.40 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 134.92 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 145.37 ($\text{C}=\text{C}\text{-C}\equiv\text{N}$), 154.08 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: C 72.06; H 7.47; N 14.83. $\text{C}_{17}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}$. Вычислено, %: C 71.90; H 7.37; N 14.72.

1-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)-3-изопропилмочевина

(4). Выход 1.2 г (42%), т. пл. 209-210°C. R_f 0.78 (бензол-этилацетат, 1:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1615 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1650 ($\text{C}=\text{O}$); 2200 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3200-3360 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/ CCl_4 — 1/3), δ , м.д., Гц: 1.15 (д,

$J=6.72$, 6H, NH-CH(CH₃)₂), 1.15 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.74 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 3.67-3.85 (м, 1H, NH-CH(CH₃)₂), 6.23 (д, $J=7.51$, 1H, NH-CH(CH₃)₂), 7.05-7.29 (м, 4H_{аром.}), 7.85 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 22.72 (NH-CH(CH₃)₂), 26.05 (C(CH₃)₂), 31.93 (C(CH₃)₂), 40.98 (NH-CH(CH₃)₂), 41.98 (CH₂-C(CH₃)₂), 107.45 (C=C-C≡N), 116.36 (C≡N), 125.08 (CH_{аром.}), 125.72 (CH_{аром.}), 127.51 (CH_{аром.}), 129.06 (CH_{аром.}), 129.41 (C_{аром.}), 134.94 (C_{аром.}), 145.36 (C=C-C≡N), 153.36 (C=O). Найдено, %: С 72.06; Н 7.47; N 14.83. C₁₇H₂₁N₃O. Вычислено, %: С 72.15; Н 7.39; N 14.90.

1-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)-3-фенилмочевина (5).

Выход 2.7 г (85%) 3-фенилмочевины **5**, т. пл. 200-201°C. R_f 0.75 (бензол-этилацетат, 4:3). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1600, 1611 (C=C Ар); 1656 (C=O); 2200 (C≡N); 3250-3350 (NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 1.21 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.82 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 6.89-6.96 (м, 1H_{аром.}), 7.14-7.32 (м, 5H_{аром.}), 7.35-7.45 (м, 3H_{аром.}), 8.29 (с, 1H, NH), 8.84 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 26.04 (C(CH₃)₂), 32.14 (C(CH₃)₂), 41.88 (CH₂-C(CH₃)₂), 109.25 (C=C-C≡N), 116.20 (C≡N), 117.85 (2(CH_{аром.})), 121.49 (CH_{аром.}), 124.93 (CH_{аром.}), 125.98 (CH_{аром.}), 127.74 (CH_{аром.}), 128.13 (2(CH_{аром.})), 129.12 (C_{аром.}), 129.37 (CH_{аром.}), 135.00 (C_{аром.}), 139.23 (C_{аром.}), 144.62 (C=C-C≡N), 151.42 (C=O). Найдено, %: С 75.69; Н 6.03; N 13.24. C₂₀H₁₉N₃O. Вычислено, %: С 75.52; Н 6.19; N 13.15.

3-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)-1,1-диметилмочевина (6). Выход 1.1 г (41%), т. пл. 169-170°C. R_f 0.71 (бензол-этанол, 10:1). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1616 (C=C Ар); 1644 (C=O); 2204 (C≡N); 3273 (NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 1.20 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.81 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 3.00 (с, 6H, N(CH₃)₂), 7.11-7.31 (м, 4H_{аром.}), 8.08 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 26.11 (C(CH₃)₂), 32.15 (C(CH₃)₂), 36.06 (N(CH₃)₂), 41.81 (CH₂-C(CH₃)₂), 112.07 (C=C-C≡N), 116.15 (C≡N), 124.71 (CH_{аром.}), 125.94 (CH_{аром.}), 127.53 (CH_{аром.}), 129.12 (CH_{аром.}), 130.01 (C_{аром.}), 134.87 (C_{аром.}), 145.75 (C=C-C≡N), 155.10 (C=O). Найдено, %: С 71.35; Н 7.11; N 15.60. C₁₆H₁₉N₃O. Вычислено, %: С 71.46; Н 7.03; N 15.67.

3-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)-1,1-диэтилмочевина (7).

Выход 1.5 г (50%), т. пл. 135-136°C. R_f 0.67 (бензол-этанол, 10:1). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1610 (C=C Ар); 1644 (C=O); 2200 (C≡N); 3221(NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: Гц: 1.20 (т, $J=7.02$, 6H, N(CH₂CH₃)₂), 1.20 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.81 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 3.37 (к, $J=7.02$, 4H, N(CH₂CH₃)₂), 7.11-7.29 (м, 4H_{аром.}), 7.94 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 13.61 (N(CH₂CH₃)₂), 26.10 (C(CH₃)₂), 32.13 (C(CH₃)₂), 40.59 (N(CH₂CH₃)₂), 41.85 (CH₂-C(CH₃)₂), 112.20 (C=C-C≡N), 116.25 (C≡N), 124.72 (CH_{аром.}), 125.90 (CH_{аром.}), 127.49 (CH_{аром.}), 129.02 (CH_{аром.}), 130.21 (C_{аром.}), 134.80 (C_{аром.}), 145.92 (C=C-

$\text{C}\equiv\text{N}$), 153.73 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: С 72.70; Н 7.80; N 14.13. $\text{C}_{18}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 72.63; Н 7.94; N 14.06.

N-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)пирролидин-1-карбоксамид (8). Выход 1.6 г (54%), т. пл. 197-198°C. R_f 0.57 (бензол-этилацетат, 1:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1600, 1610 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1675 ($\text{C}=\text{O}$); 2196 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3200-3400 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 1.20 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 1.92-2.02 (м, 4H, $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 2.81 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 3.38-3.48 (м, 4H, $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 7.11-7.39 (м, 4H_{аром.}), 7.87 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 24.96 ($\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 26.10 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 32.14 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 41.81 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 45.47 ($\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2)_2$), 112.17 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 116.16 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 124.94 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 125.91 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.50 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.11 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 130.01 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 134.83 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 145.43 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 153.18 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: С 73.19; Н 7.17; N 14.23. $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 73.09; Н 7.24; N 14.19.

N-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)пиперидин-1-карбоксамид (9). Выход 1.9 г (61%), т. пл. 204-205°C. R_f 0.73 (бензол-этилацетат, 1:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1612 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1644 ($\text{C}=\text{O}$); 2200 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3221 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 1.20 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 1.55-1.74 (м, 6H, $(\text{CH}_2)_3$ пиперидин), 2.80 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 3.42-3.50 (м, 4H, $\text{N}(\text{CH}_2)_2$ пиперидин), 7.11-7.17 (м, 1H_{аром.}), 7.17-7.31 (м, 3H_{аром.}), 8.16 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 24.18 ((CH_2) пиперидин), 25.29 ($(\text{CH}_2)_2$ пиперидин), 26.14 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 32.10 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 41.85 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 44.93 ($\text{N}(\text{CH}_2)_2$ пиперидин), 111.54 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 116.21 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 124.61 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 125.93 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.52 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.07 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 130.05 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 134.90 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 145.82 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 154.27 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: С 73.76; Н 7.49; N 13.58. $\text{C}_{19}\text{H}_{23}\text{N}_3\text{O}$. Вычислено, %: С 73.62; Н 7.38; N 13.47.

N-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)морфолин-4-карбоксамид (10). Выход 2.4 г (77%), т. пл. >230°C (сублимирует). R_f 0.53 (бензол-этанол, 10:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1610 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1641 ($\text{C}=\text{O}$); 2203 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3216 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 1.21 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 2.81 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 3.46-3.52 (м, 4H, $\text{N}(\text{CH}_2)_{2\text{морф.}}$), 3.62-3.68 (м, 4H, $\text{O}(\text{CH}_2)_{2\text{морф.}}$), 7.12-7.18 (м, 1H_{аром.}), 7.19-7.32 (м, 3H_{аром.}), 8.35 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 26.13 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 32.21 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 41.80 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 44.37 ($\text{N}(\text{CH}_2)_{2\text{морф.}}$), 65.89 ($\text{O}(\text{CH}_2)_{2\text{морф.}}$), 112.26 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 116.13 ($\text{C}\equiv\text{N}$), 124.57 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 126.03 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.63 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.26 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 129.89 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 134.96 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 145.45 ($\text{C}=\text{C}-\text{C}\equiv\text{N}$), 154.64 ($\text{C}=\text{O}$). Найдено, %: С 69.43; Н 6.80; N 13.49. $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{O}_2$. Вычислено, %: С 69.34; Н 6.72; N 13.56.

N-(3,3-Диметил-2-циано-3,4-дигидронафталин-1-ил)азепан-1-карбоксамид (11). Выход 1.6 г (49%), т. пл. 177-178°C. R_f 0.71 (бензол-этилацетат, 1:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1612 ($\text{C}=\text{C}$ Аp); 1640 ($\text{C}=\text{O}$); 2208 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 3229 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 1.21 (с, 6H,

$C(CH_3)_2$, 1.58-1.84 (м, 8H, $N(CH_2CH_2CH_2)_2$), 2.81 (с, 2H, $\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 3.44-3.52 (м, 4H, $N(\underline{CH_2}CH_2CH_2)_2$), 7.12-7.31 (м, 4H_{аром.}), 7.92 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 26.11 ($C(\underline{CH_3})_2$), 26.40 ($N(CH_2CH_2CH_2)_2$), 28.03 ($N(CH_2CH_2CH_2)_2$), 32.14 ($\underline{C}(CH_3)_2$), 41.85 ($\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 46.42 ($N(\underline{CH_2}CH_2CH_2)_2$), 112.25 ($C=\underline{C}-C\equiv N$), 116.21 ($C\equiv N$), 124.72 (CH_{аром.}), 125.90 (CH_{аром.}), 127.50 (CH_{аром.}), 129.05 (CH_{аром.}), 130.21 (C_{аром.}), 134.83 (C_{аром.}), 145.84 ($\underline{C}=C-C\equiv N$), 154.17 ($C=O$). Найдено, %: C 74.27; H 7.79; N 12.99. C₂₀H₂₅N₃O₂. Вычислено, %: C 74.32; H 7.63; N 13.05.

Общая методика синтеза триазолов 12-22. Смесь 3.2 г (0.01 моля) карбамата **2**, 0.01 моля гидразида и 30 мл диметилформамида кипятят с обратным холодильником в течение 10 ч. Затем реакционную смесь охлаждают и прибавляют 25 мл воды. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают смесью этанол-вода (2:1). Осадок перекристаллизовывают из этанола.

4,4-Диметил-2-(пиридин-4-ил)-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хи-назолин-11(10H)-он (12). Выход 1.7 г (50%), т. пл. >250°C. R_f 0.39 (толуол-этанол, 7:1). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1595, 1612 ($C=C$ Ар); 1739 ($C=O$). Спектр ЯМР 1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.52 (с, 6H, $C(CH_3)_2$), 2.88 (с, 2H, $\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 7.23-7.41 (м, 3H_{аром.}), 7.95-8.02 (м, 1H_{аром.}), 8.08-8.14 (м, 2H_{аром.}), 8.66-8.72 (м, 2H_{аром.}), 12.10 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 26.19 ($C(\underline{CH_3})_2$), 32.49 ($\underline{C}(CH_3)_2$), 44.02 ($\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 110.51 ($\underline{C}=C-NH$), 120.57 (2(CH_{пир.})), 123.78 (CH_{аром.}), 125.82 ($C=\underline{C}-NH$), 126.55 (CH_{аром.}), 128.01 (CH_{аром.}), 129.75 (CH_{аром.}), 135.72 (C_{аром.}), 137.03 (C_{аром.}), 137.57 (C_{пир.}), 144.35 ($N=C-N$), 149.64 (2(CH_{пир.})), 154.41 ($C=O$), 161.24 ($N=C-Ph$). Найдено, %: C 69.96; H 4.99; N 20.40. C₂₀H₁₇N₅O. Вычислено, %: C 69.88; H 4.92; N 20.51.

4,4-Диметил-2-фенил-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (13). Выход 1.8 г (53%), т. пл. >250°C. R_f 0.66 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1590, 1605 ($C=C$ Ар); 1731 ($C=O$); 3100-3250 (NH). Спектр ЯМР 1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.53 (с, 6H, $C(CH_3)_2$), 2.88 (с, 2H, $\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 7.23-7.40 (м, 3H_{аром.}), 7.42-7.53 (м, 3H_{аром.}), 7.94-8.02 (м, 1H_{аром.}), 8.21-8.29 (м, 2H_{аром.}), 11.95 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 26.24 ($C(\underline{CH_3})_2$), 32.52 ($\underline{C}(CH_3)_2$), 44.13 ($\underline{CH_2}-C(CH_3)_2$), 110.56 ($\underline{C}=C-NH$), 123.65 (CH_{аром.}), 125.99 ($C=\underline{C}-NH$), 126.50 (CH_{аром.}), 126.79 (2(CH_{аром.})), 127.91 (2(CH_{аром.})), 127.96 (CH_{аром.}), 129.40 (CH_{аром.}), 129.53 (CH_{аром.}), 130.05 (C_{аром.}), 135.65 (C_{аром.}), 136.98 (C_{аром.}), 144.53 ($N=C-N$), 154.03 ($C=O$), 163.13 ($N=C-Ph$). Найдено, %: C 73.67; H 5.30; N 16.36. C₂₁H₁₈N₄O₂. Вычислено, %: C 73.52; H 5.42; N 16.27.

2-Бензил-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (14). Выход 2.7 г (76%), т. пл. 237-238°C. R_f 0.61 (толуол-этанол, 7:1). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1600, 1609 ($C=C$ Ар); 1707 ($C=O$); 3120-3270

(NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.44 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.83 (с, 2H, $\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 4.14 (с, 2H, CH₂-Ph), 7.13-7.40 (м, 8H_{аром.}), 7.89-7.96 (м, 1H_{аром.}), 11.85 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 26.14 (C($\underline{\text{CH}}_3$)₂), 32.42 ($\underline{\text{C}}(\text{CH}_3)_2$), 34.44 (CH₂-Ph), 44.13 ($\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 110.49 ($\underline{\text{C}}=\text{C-NH}$), 123.57 (CH_{аром.}), 125.82 (CH_{аром.}), 126.00 (C= $\underline{\text{C}}\text{-NH}$), 126.47 (CH_{аром.}), 127.72 (2(CH_{аром.})), 127.91 (CH_{аром.}), 128.43 (2(CH_{аром.})), 129.45 (CH_{аром.}), 135.59 (C_{аром.}), 136.72 (C_{аром.}), 137.07 (C_{аром.}), 144.41 (N=C-N), 153.73 (C=O), 165.10 (N= $\underline{\text{C}}\text{-CH}_2\text{-Ph}$). Найдено, %: C 74.14; H 5.66; N 15.72. C₂₂H₂₀N₄O. Вычислено, %: C 74.24; H 5.60; N 15.61.

2-(4-Бромфенил)-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (15). Выход 2.2 г (52%), т. пл. >250°C. R_f 0.80 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1600, 1610 (C=C Ар); 1721 (C=O); 3160-3320 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.52 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.87 (с, 2H, $\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 7.22-7.28 (м, 1H_{аром.}), 7.29-7.40 (м, 2H_{аром.}), 7.59-7.65 (м, 2H_{аром.}), 7.95-8.01 (м, 1H_{аром.}), 8.14-8.20 (м, 2H_{аром.}), 11.98 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 26.22 (C($\underline{\text{CH}}_3$)₂), 32.49 ($\underline{\text{C}}(\text{CH}_3)_2$), 44.08 ($\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 110.47 ($\underline{\text{C}}=\text{C-NH}$), 123.58 (C_{аром.}), 123.70 (CH_{аром.}), 125.90 (C= $\underline{\text{C}}\text{-NH}$), 126.51 (CH_{аром.}), 127.96 (CH_{аром.}), 128.47 (2(CH_{аром.})), 129.14 (C_{аром.}), 129.61 (CH_{аром.}), 131.10 (2(CH_{аром.})), 135.66 (C_{аром.}), 137.22 (C_{аром.}), 144.41 (N=C-N), 154.15 (C=O), 162.23 (N=C-Ph). Найдено, %: C 59.87; H 4.07; Br 18.97; N 13.30. C₂₁H₁₇BrN₄O. Вычислено, %: C 59.95; H 4.16; Br 18.87; N 13.15.

4,4-Диметил-2-[(о-толилокси)метил]-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (16). Выход 1.7 г (44%), т. пл. 239-240°C. R_f 0.84 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1595, 1610 (C=C Ар); 1717 (C=O); 3150-3350 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.46 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.26 (с, 3H, $\underline{\text{CH}}_3\text{-Ph}$), 2.85 (с, 2H, $\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 5.24 (с, 2H, OCH₂), 6.77-6.84 (м, 1H_{аром.}), 7.02-7.15 (м, 3H_{аром.}), 7.20-7.40 (м, 3H_{аром.}), 7.92-7.99 (м, 1H_{аром.}), 11.98 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 15.86 ($\underline{\text{CH}}_3\text{-Ph}$), 26.12 (C($\underline{\text{CH}}_3$)₂), 32.45 ($\underline{\text{C}}(\text{CH}_3)_2$), 44.09 ($\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 63.20 (OCH₂), 110.62 ($\underline{\text{C}}=\text{C-NH}$), 111.48 (CH_{аром.}), 120.28 (CH_{аром.}), 123.69 (CH_{аром.}), 125.92 (C= $\underline{\text{C}}\text{-NH}$), 126.16 (CH_{аром.}), 126.16 (C_{аром.}), 126.53 (CH_{аром.}), 127.97 (CH_{аром.}), 129.62 (CH_{аром.}), 129.99 (CH_{аром.}), 135.68 (C_{аром.}), 137.17 (C_{аром.}), 144.44 (N=C-N), 153.97 (C=O), 156.10 (N= $\underline{\text{C}}\text{-CH}_2\text{-O-Ph}$), 162.20 (C_{аром.}). Найдено, %: C 71.48; H 5.74; N 14.50. C₂₃H₂₂N₄O₂. Вычислено, %: C 71.35; H 5.88; N 14.32.

4,4-Диметил-2-[(м-толилокси)метил]-4,5-дигидробензо[h][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (17). Выход 1.6 г (41%), т. пл. >250°C. R_f 0.83 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν , см⁻¹: 1595, 1610 (C=C Ар); 1723 (C=O); 2200 (C $\equiv$ N); 3150-3320 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ , м.д.: 1.47 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.33 (с, 3H, $\underline{\text{CH}}_3\text{-Ph}$), 2.85 (с, 2H, $\underline{\text{CH}}_2\text{-C(CH}_3)_2$), 5.20 (с, 2H, OCH₂), 6.68-6.90 (м, 3H_{аром.}), 7.07-

7.16 (м, 1H_{аром.}), 7.20-7.40 (м, 3H_{аром.}), 7.92-7.99 (м, 1H_{аром.}), 11.98 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 20.97 (CH₃-Ph), 26.14 (C(CH₃)₂), 32.43 (C(CH₃)₂), 44.08 (CH₂-C(CH₃)₂), 62.80 (OCH₂), 110.61 (C=C-NH), 111.40 (CH_{аром.}), 115.23 (CH_{аром.}), 121.27 (CH_{аром.}), 123.70 (CH_{аром.}), 125.90 (C=C-NH), 126.51 (CH_{аром.}), 127.96 (CH_{аром.}), 128.50 (CH_{аром.}), 129.61 (CH_{аром.}), 135.67 (C_{аром.}), 137.19 (C_{аром.}), 138.26 (C_{аром.}), 144.40 (N=C-N), 153.93 (C=O), 157.94 (N=C-CH₂-O-Ph), 162.02 (C_{аром.}). Найдено, %: С 71.48; Н 5.74; N 14.50. C₂₃H₂₂N₄O₂. Вычислено, %: С 71.55; Н 5.67; N 14.61.

4,4-Диметил-2-[(п-толилокси)метил]-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (18). Выход 1.8 г (47%), т. пл. >250°C. R_f 0.80 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1600, 1610 (C=C Ар); 1716 (C=O); 3160-3250 (NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 1.46 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.28 (с, 3H, CH₃-Ph), 2.85 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 5.18 (с, 2H, OCH₂), 6.89-6.95 (м, 2H_{аром.}), 7.01-7.07 (м, 2H_{аром.}), 7.21-7.28 (м, 1H_{аром.}), 7.29-7.39 (м, 2H_{аром.}), 7.93-7.99 (м, 1H_{аром.}), 11.98 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 19.97 (CH₃-Ph), 26.16 (C(CH₃)₂), 32.45 (C(CH₃)₂), 44.09 (CH₂-C(CH₃)₂), 63.02 (OCH₂), 110.63 (C=C-NH), 114.35 (2(CH_{аром.})), 123.71 (CH_{аром.}), 125.93 (C=C-NH), 126.53 (CH_{аром.}), 127.97 (CH_{аром.}), 129.20 (2(CH_{аром.})), 129.23 (C_{аром.}), 129.62 (CH_{аром.}), 135.69 (C_{аром.}), 137.18 (C_{аром.}), 144.43 (N=C-N), 153.95 (C=O), 155.88 (N=C-CH₂-O-Ph), 162.10 (C_{аром.}). Найдено, %: С 71.48; Н 5.74; N 14.50. C₂₃H₂₂N₄O₂. Вычислено, %: С 71.42; Н 5.68; N 14.41.

2-[(2-Хлорфенокси)метил]-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (19). Выход 1.9 г (47%), т. пл. >250°C. R_f 0.80 (бензол-этилацетат, 1:2). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1612 (C=C Ар); 1708 (C=O); 3170-3350 (NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 1.46 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.85 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 5.33 (с, 2H, OCH₂), 6.88-6.95 (м, 1H_{аром.}), 7.18-7.40 (м, 6H_{аром.}), 7.92-7.99 (м, 1H_{аром.}), 12.02 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ¹³C (75 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д.: 26.11 (C(CH₃)₂), 32.43 (C(CH₃)₂), 44.05 (CH₂-C(CH₃)₂), 63.87 (OCH₂), 110.61 (C=C-NH), 114.20 (CH_{аром.}), 121.31 (CH_{аром.}), 122.31 (C_{аром.}), 123.70 (CH_{аром.}), 125.88 (C=C-NH), 126.52 (CH_{аром.}), 127.15 (CH_{аром.}), 127.97 (CH_{аром.}), 129.58 (CH_{аром.}), 129.65 (CH_{аром.}), 135.69 (C_{аром.}), 137.32 (C_{аром.}), 144.39 (N=C-N), 153.53 (N=C-CH₂-O-Ph), 154.00 (C=O), 161.50 (C_{аром.}). Найдено, %: С 64.94; Н 4.71; Cl 8.71; N 13.77. C₂₂H₁₉ClN₄O₂. Вычислено, %: С 64.88; Н 4.79; Cl 8.62; N 13.67.

2-(4-Этоксифенил)-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10H)-он (20). Выход 1.8 г (47%), т. пл. >250°C. R_f 0.55 (толуол-этанол, 7:1). ИК-спектр: ν, см⁻¹: 1594, 1612 (C=C Ар); 1716 (C=O); 3100-3250 (NH). Спектр ЯМР ¹H (300 МГц, DMSO/CCl₄ – 1/3), δ, м.д., Гц: 1.44 (т, J=6.93, 3H, OCH₂CH₃), 1.52 (с, 6H, C(CH₃)₂), 2.87 (с, 2H, CH₂-C(CH₃)₂), 4.11 (к, J=6.93, 2H, OCH₂CH₃), 6.93-6.99 (м, 2H_{аром.}), 7.22-7.39 (м, 3H_{аром.}), 7.93-8.00 (м, 1H_{аром.}), 8.11-8.17 (м, 2H_{аром.}), 11.88 (с, 1H, NH).

Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/ CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 14.29 (OCH_2CH_3), 26.23 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 32.49 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 44.13 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 62.63 (OCH_2CH_3), 110.47 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 113.80 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 122.35 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 123.59 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 126.03 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 126.46 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.91 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 128.23 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 129.43 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 135.60 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 136.74 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 144.51 ($\text{N}=\text{C-N}$), 153.86 ($\text{C}=\text{O}$), 159.93 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 163.08 ($\text{N}=\text{C-Ph}$). Найдено, %: С 71.48; Н 5.74; N 14.50. $\text{C}_{23}\text{H}_{22}\text{N}_4\text{O}_2$. Вычислено, %: С 71.55; Н 5.79; N 14.41.

2-(4-Бутоксифенил)-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10Н)-он (21). Выход 2 г (48%), т. пл. $>250^\circ\text{C}$. R_f 0.51 (толуол-этанол, 7:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1600, 1612 ($\text{C}=\text{C Ar}$); 1707 ($\text{C}=\text{O}$); 3100-3350 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/ CCl_4 – 1/3), δ , м.д., Гц: 1.01 (т, $J=7.34$, 3H, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 1.46-1.60 (м, 2H, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 1.52 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 1.73-1.85 (м, 2H, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 2.87 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 4.03 (т, $J=6.41$, 2H, $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 6.92-6.98 (м, $2\text{H}_{\text{аром.}}$), 7.22-7.39 (м, $3\text{H}_{\text{аром.}}$), 7.93-8.00 (м, $1\text{H}_{\text{аром.}}$), 8.11-8.17 (м, $2\text{H}_{\text{аром.}}$), 11.88 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/ CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 13.41 ($\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 18.64 ($\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 26.25 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 30.68 ($\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 32.50 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 44.15 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 66.85 ($\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$), 110.48 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 113.82 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 122.35 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 123.60 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 126.03 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 126.47 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.93 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 128.22 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 129.44 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 135.62 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 136.75 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 144.53 ($\text{N}=\text{C-N}$), 153.87 ($\text{C}=\text{O}$), 160.12 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 163.10 ($\text{N}=\text{C-Ph}$). Найдено, %: С 72.44; Н 6.32; N 13.52. $\text{C}_{25}\text{H}_{26}\text{N}_4\text{O}_2$. Вычислено, %: С 72.34; Н 6.41; N 13.42.

2-(4-Изобутоксифенил)-4,4-диметил-4,5-дигидробензо[*h*][1,2,4]триазоло[1,5-с]хиназолин-11(10Н)-он (22). Выход 2.2 г (53%), т. пл. $>250^\circ\text{C}$. R_f 0.55 (толуол-этанол, 7:1). ИК-спектр: ν , см^{-1} : 1600, 1614 ($\text{C}=\text{C Ar}$); 1704 ($\text{C}=\text{O}$); 3200-3350 (NH). Спектр ЯМР ^1H (300 МГц, DMSO/ CCl_4 – 1/3), δ , м.д., Гц: 1.07 (д, $J=6.74$, 6H, $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 1.53 (с, 6H, $\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 2.03-2.19 (м, 1H, $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 2.87 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 3.80 (д, $J=6.38$, 2H, $\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 6.93-6.99 (м, $2\text{H}_{\text{аром.}}$), 7.22-7.39 (м, $3\text{H}_{\text{аром.}}$), 7.93-8.00 (м, $1\text{H}_{\text{аром.}}$), 8.11-8.17 (м, $2\text{H}_{\text{аром.}}$), 11.88 (с, 1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C (75 МГц, DMSO/ CCl_4 – 1/3), δ , м.д.: 18.80 ($\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 26.25 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 27.64 ($\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 32.49 ($\text{C}(\text{CH}_3)_2$), 44.15 ($\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2$), 73.55 ($\text{OCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$), 110.49 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 113.85 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 122.39 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 123.59 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 126.03 ($\text{C}=\text{C-NH}$), 126.47 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 127.92 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 128.20 ($2(\text{CH}_{\text{аром.}})$), 129.43 ($\text{CH}_{\text{аром.}}$), 135.62 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 136.74 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 144.52 ($\text{N}=\text{C-N}$), 153.87 ($\text{C}=\text{O}$), 160.18 ($\text{C}_{\text{аром.}}$), 163.08 ($\text{N}=\text{C-Ph}$). Найдено, %: С 72.44; Н 6.32; N 13.52. $\text{C}_{25}\text{H}_{26}\text{N}_4\text{O}_2$. Вычислено, %: С 72.32; Н 6.40; N 13.42.

Исследование выполнено при финансовой поддержке Государственного комитета по науке МОН РА в рамках научного проекта №15Т-1Д149.

**(3,3-ԴԻՄԵԹԻԼ-2-ՑԻԱՆ-3,4-ԴԻՆԴԻՐՈՆԱՎԱԺԱԼԻՆ-1-
ԻԼ)ՖԵՆԻԼԿԱՐԲԱՄԱՏԻ ՍԻՆԹԵԶԸ ԵՎ ՓՈԽԱՐԿՈՒՄՆԵՐԸ**

**Ա. Ի. ՄԱՐԿՈՍՅԱՆ, Կ. Կ. ՀԱՅՐԱՊԵՏՅԱՆ, Ս. Հ. ԳԱԲՐԻԵԼՅԱՆ, Ս. Ս. ՄԱՄՅԱՆ,
Ջ. Ա. ԱՎԱԿԻՄՅԱՆ և Ն. Մ. ՍՏԵՓԱՆՅԱՆ**

*1-Ամինո-3,3-դիմեթիլ-3,4-դիհիդրոնավթալին-2-կարբոնիտրիլի և ֆենիլքլորֆորմիա-
տի կոնդենսման հիման վրա սինթեզվել է (3,3-դիմեթիլ-2-ցիան-3,4-դիհիդրոնավթալին-
1-իլ)ֆենիլկարբամատ: Վերջինիս փոխազդեցությունը առաջնային և երկրորդային ամին-
ների հետ բերել է համապատասխանաբար երկ- և եռտեղակալված միզանյութերի ստաց-
մանը: Վերոհիշյալ կարբամատի և արոմատիկ, ալկոքսիարոմատիկ ու հետերոարոմատիկ
թթուների հիդրազիդների ռեակցիայի արդյունքում սինթեզվել են 2-տեղակալված 4,4-
դիմեթիլ-4,5-դիհիդրոբենզո[h][1,2,4]տրիազոլ[1,5-c]խինազոլին-11(10H)-ոններ:
Կենսաբանական հետազոտությունները ցույց են տվել, որ ուսումնասիրված միացու-
թյունների մեծ մասը դրամդրական և դրամբացասական միկրոօրգանիզմների նկատմամբ
ցուցաբերում է թույլ կամ միջին ակտիվություն:*

**SYNTHESIS AND TRANSFORMATIONS OF (3,3-DIMETHYL-2-CYANO-3,4-
DIHYDRONAPHTHALENE-1-IL)PHENYL CARBAMATE**

**A. I. MARKOSYAN, K. K. HAYRAPETYAN, S. H. GABRIELIAN, S. S. MAMYAN,
J. A. AVAKIMYAN and H. M. STEPANYAN**

Scientific and Technological Center of Organic
and Pharmaceutical Chemistry of NAS RA
26, Azatutyan Ave., Yerevan, 0014, Armenia
Phone: +374 10 288 443. E-mail: ashot@markosyan.am

The reaction of 1-amino-3,3-dimethyl-3,4-dihydronaphthalene-2-carbonitrile (1) with phenylchloroformate a method was developed for obtaining (3,3-dimethyl-2-cyano-3,4-dihydronaphthalene-1-yl)phenylcarbamate (2). Carbamate 2 was put into reaction with primary (propylamine, isopropylamine and aniline) and secondary amines (dimethylamine, diethylamine, pyrrolidine, piperidine, morpholine and azepan), which led to the formation of disubstituted (3-5) and trisubstituted (6-11) urea dihydronaphthalene series. The synthesis of the desired 2-substituted 4,4-dimethyl-4,5-dihydrobenzo[h][1,2,4]triazolo[1,5-c]quinazoline-11(10H)-ones (12-22) was carried out by condensation of carbamate 2 with hydrazides of various carboxylic acids (isonicotinic, benzoic, 4-bromobenzoic, 4-ethoxybenzoic, 4-butoxybenzoic, 4-iso-butoxybenzoic, phenylacetic, 2-(o-tolyloxyacetic, 2-m-tolyloxyacetic, 2-p-tolyloxyacetic).

The antibacterial activity of the synthesized compounds was studied by the method of “diffusion in agar” at a microbial load of 20 million microbial bodies per 1 ml of environment. As test objects, gram-positive staphylococci are used (Staph. Aureus 209p, 1) and gram-negative rods (Sh. dysenteriae Flexneri 6858, E. Coli 0-55). The calculation of the results is carried out according to the diameter (d) of the no-growth zones of microorganisms at the site of application of compounds (in mm). Most of the compounds studied showed weak or moderate activity against gram-positive and gram-negative microorganisms in 10-16 mm diameter zone.

ЛИТЕРАТУРА

- [1] *Feng Y., Ding X., Chen T., Chen L., Liu F., Jia X., Luo X., Liu D.* // J. Med. Chem., 2010, v. 53 (9), p. 3465.
- [2] *Patil A., Ganguly S., Surana S., Pekamwar S., Sangamwar A.* // Int. J. Pharm. Tech. Res., 2009, v. 1 (4), p. 1227.
- [3] *Mikshiev V.Y., Antonov A.S., Pozharski A.F.* // Org. Lett., 2016, v. 18 (12), p. 2872.
- [4] *Reddy R.S., Prasad P.K., Ahuja B.B., Sudalai A.* // J. Org. Chem., 2013, v. 78 (10), p. 5045.
- [5] *Ramesh G., Gali R., Velpula R., Rajitha B.* // Res. Chem. Intermed., 2016, v.42, Issue 4, p. 3863.
- [6] *Wei W., Li Ch., Wang T., Liu D., Zhang N.* // Tetrahedron, 2016, v. 72, Issue 33, p. 5037.
- [7] *Verbitskiy E.V., Rusinov G.L., Chupakhin O.N., Charushin V.N.* // ARKIVOC, 2016, (iv), p. 204.
- [8] *Григорян Н.П., Тарзян Л.А., Маркосян А.И., Пароникян Р.Г., Сукасян Р.С.* // Хим. ж. Армении, 2009, т. 62, № 1-2, с. 160.
- [9] *Маркосян А.И., Диланян С.В., Арсенян Ф.Г., Сукасян Р.С., Гарибджанян Б.Т.* // Хим.-фарм. ж., 2010, т.44, № 3, с. 3.
- [10] *Григорян Н.П., Маркосян А.И., Варданян Н. А., Авакимян Д.Л., Степанян Г.М.* // Хим. ж. Армении, 2011, т.64, № 3, с. 394.
- [11] *Маркосян А.И., Торширзад Н.М., Габриелян С.А., Шахатуни Р.К., Авакимян Дж.А.* // Материалы 3-ей научной конференции АХО «Успехи в области органической и фармацевтической химии». Ереван, 2012, с. 34.
- [12] *Маркосян А.И., Торширзад Н.М., Габриелян С.А.* //Хим. ж. Армении, 2013, т. 66, № 1, с. 110.
- [13] *Markosyan A.I., Torshirzad N.M., Gabrielyan S.H., Papanyan N.J., Avakimyan J.A.* // Electronic J. Nat. Sci. NAS RA, 2013, v. 1(20), p. 17.
- [14] *Markosyan A.I., Torshirzad N.M., Gabrielyan S.H., Mkrtchyan D.A., Stepanyan H.M., Avakimyan J.A.* // Electronic J. Nat. Sci. NAS RA, 2014, v. 1(22), p. 26.
- [15] *Маркосян А.И., Габриелян С.А., Авакимян Дж.А., Степанян Г.М.* // Сборник трудов НТЦОФХ, выпуск-2, Ереван, 2015, с. 194.
- [16] *Markosyan A.I., Hayrapetyan K.K., Gabrielyan S.H., Mamyas S.S., Avakimyan J.A.* // Electronic J. Nat. Sci. NAS RA, 2016, v. 2(27), p. 3.
- [17] *Markosyan A.I., Dilanyan S.V., Gabrielyan S.H., Mamyas S.S.* // Electronic J. Nat. Sci. NAS RA, 2016, v. 2(27), p. 23.
- [18] *Григорян Н.П., Маркосян А.И., Григорян А.С., Степанян Г.А., Сукасян Р.С., Пароникян Р.Г.* // Хим.-фарм. ж., 2017, т. 51, №2, с. 11.
- [19] *Григорян Н.П., Маркосян А.И., Пароникян Р.Г., Сукасян Р.С.* // Хим.-фарм. ж., 2017, т. 51, №8, с. 3.
- [20] *Маркосян А.И., Айрапетян К.К., Габриелян С.А., Мамян С.С., Авакимян Дж.А., Степанян Г.М.* // Хим. ж. Армении, 2017, т. 70, №3, с. 368.
- [21] *Руководство по проведению доклинических исследований лекарственных средств. / под ред. А.Н.Миронова, М., 2012.*