

В. А. Рассадин, А. А. Томашевский, В. В. Соколов,
А. А. Потехин

СИНТЕЗ СУЛЬТАМОВ ПУТЕМ ЦИКЛОАЛКИЛИРОВАНИЯ (АЛКОКСИКАРБОНИЛМЕТАН)СУЛЬФАНИЛИДОВ

(Метоксикарбонилметан)сульфанилиды алкилируются α,ω -дигалогеналканами в системе K_2CO_3 -ДМФА с образованием сультамов. Обнаружена высокая чувствительность скорости реакции к электронным эффектам заместителей в ароматическом ядре, причем заместители в *орто*-положении не препятствуют протеканию реакции, а в случае 2,6-дизамещенных производных скорость и выходы сультамов максимальны.

Третичные сульфамиды образуют в этих условиях производные 1-сульфамойл-циклопропанкарбоновой кислоты.

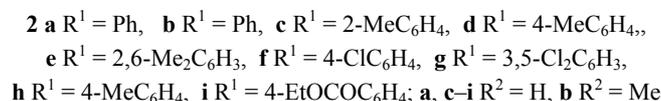
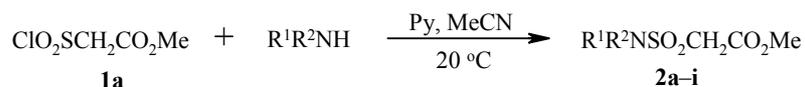
Ключевые слова: (метоксикарбонилметан)сульфанилиды, сультамы, циклопропаны, гетероциклизация.

Многие соединения, имеющие в своем составе сульфамидную группу, применяются в лечебной практике, например, в качестве антибактериальных или гипогликемических препаратов [1, 2]. И по сей день интерес к сульфамидам, как потенциальным лекарственным препаратам, достаточно велик [3, 4].

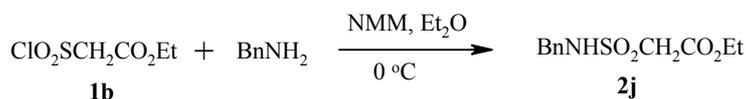
Хотя общепринятым методом получения сульфамидов является взаимодействие сульфохлоридов с аминами, синтез циклических аналогов (сультамов) не столь прост. Одним из возможных решений является внутримолекулярное алкилирование сульфамидов, где способы создания электрофильного центра могут быть разнообразными. В этой связи очевидным достоинством могут обладать реакции циклоалкилирования с участием сульфамидов, имеющих дополнительный С-нуклеофильный центр, с дигалогенидами или их эквивалентами.

С этой точки зрения большим потенциалом обладают получающиеся из легкодоступных алкоксикарбонилметансульфохлоридов **1a,b** сульфамиды **2** [5]. Хотя для этих сульфамидов известны гетероциклизации на основе внутримолекулярной конденсации карбонильной и активной метиленовой группы [6] или метатезиса С,N-диаллильных производных [7], их алкилирование алифатическими дигалогенидами не описано и привлекло наше внимание.

В качестве исходных были получены сульфамиды **2a-i** (табл. 1, 2).

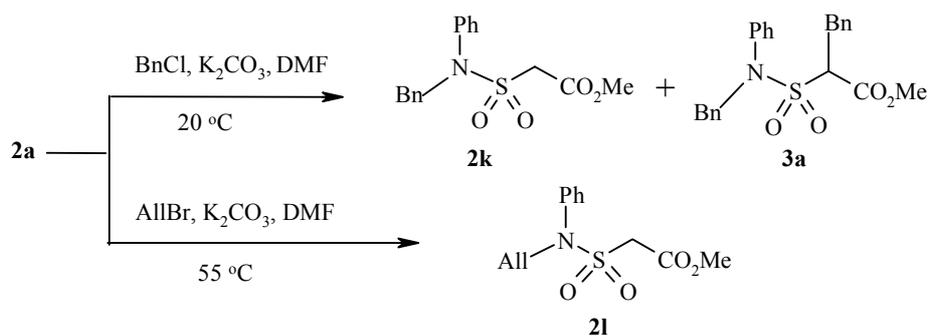


Взаимодействие сульфохлорида **1a** с анилинами протекает без осложнений со стороны сложноэфирной группы и приводит к сульфидам **2a-i** с высоким выходом. В то же время в алифатическом ряду даже не очень нуклеофильный бензиламин начинает конкурентно реагировать со сложным эфиром. Во избежание этого осложнения для получения N-бензилсульфида **2j** пришлось использовать этиловый эфир **1b** и проводить реакцию при пониженной температуре.

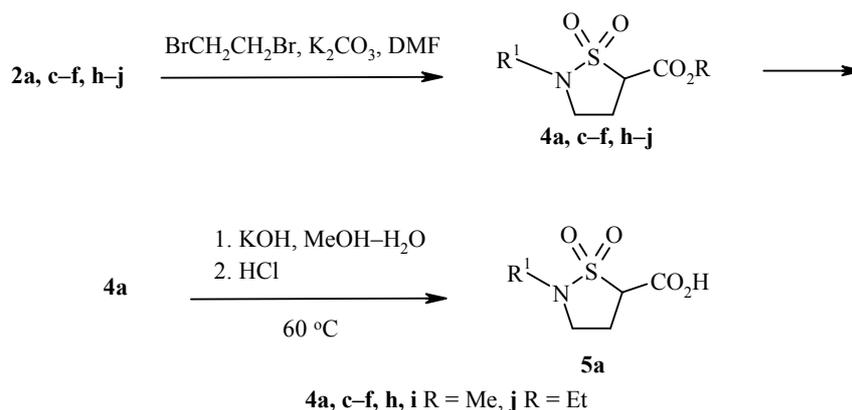


NMM – N-метилморфолин

В сульфидах **2a,c-j** существуют два нуклеофильных центра с не ясной заранее относительной реакционной способностью. И действительно, при взаимодействии сульфида **2a** с эквимолярным количеством бензилхлорида в системе K₂CO₃-DMF образуется смесь продуктов N- и C,N-алкилирования (**2k** и **3a** соответственно) в соотношении 4:3.



Однако при использовании разбавленного раствора аллилбромиды удается провести реакцию таким образом, что продукт N-алкилирования **2l** является единственным.



Алкилирование сульфамидов **2a,c-j** 1,2-дибромэтаном в этой же системе приводит к желаемым сультам **4** (табл. 3, 4). При высокой степени конверсии сульфида **2a** наблюдается образование продукта дальнейшего алкилирования неустановленного строения. Переход к менее полярному ацетонитрилу или протонному растворителю, а также замена поташа на более слабое основание, могли бы повысить выход сультама **4a**. Однако в метаноле реакция не идет, а при использовании ацетонитрила в комбинации с различными основаниями (карбонат калия, триэтиламин, N,N-диметиланилин) ее скорость сильно снижается.

Таким образом, система K_2CO_3 -ДМФА оказалась наиболее подходящей для получения сультама **4a** в разбавленном растворе.

Т а б л и ц а 1

Алксокарбонилметансульфамиды **2a-j**

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	Выход, %
		С	Н	N		
2a	$\text{C}_9\text{H}_{11}\text{NO}_4\text{S}$				79–80 [7]	74
2b	$\text{C}_{10}\text{H}_{13}\text{NO}_4\text{S}$	<u>49.36</u>	<u>5.38</u>	<u>5.93</u>	63–64	79
		49.37	5.39	5.76		
2c	$\text{C}_{10}\text{H}_{13}\text{NO}_4\text{S}$	<u>49.20</u>	<u>5.50</u>	<u>6.05</u>	55–56	72
		49.37	5.39	5.76		
2d	$\text{C}_{10}\text{H}_{13}\text{NO}_4\text{S}$	<u>49.36</u>	<u>5.60</u>	<u>6.02</u>	77–79	85
		49.37	5.39	5.76		
2e	$\text{C}_{11}\text{H}_{15}\text{NO}_4\text{S}$	<u>51.42</u>	<u>5.74</u>	<u>5.57</u>	105–106	82
		51.35	5.88	5.44		
2f	$\text{C}_9\text{H}_{10}\text{ClNO}_4\text{S}$	<u>41.12</u>	<u>4.09</u>	<u>5.33</u>	99–100	72
		40.99	3.82	5.31		
2g	$\text{C}_9\text{H}_9\text{Cl}_2\text{NO}_4\text{S}$	<u>36.03</u>	<u>3.18</u>	<u>4.73</u>	132–133	78
		36.26	3.04	4.70		
2h	$\text{C}_{10}\text{H}_{13}\text{NO}_5\text{S}$	<u>46.23</u>	<u>5.05</u>	<u>5.54</u>	85–86	71
		46.32	5.05	5.40		
2i	$\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{NO}_6\text{S}$	<u>47.63</u>	<u>4.98</u>	<u>4.62</u>	98–99	83
		47.83	5.02	4.65		
2j	$\text{C}_{11}\text{H}_{15}\text{NO}_4\text{S}$	<u>51.42</u>	<u>5.67</u>	<u>5.30</u>	56–57	60
		51.35	5.88	5.44		

Спектральные характеристики сульфонамидов

Соединение	ЯМР ^1H (CDCl_3), δ , м. д. (J , Гц)	ЯМР ^{13}C (CDCl_3), δ , м. д.	Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %)
2b	3.43 (3H, c, NCH_3); 3.82 (3H, c, OCH_3); 3.98 (2H, c, SO_2CH_2), 7.32–7.51 (5H, м, ArH)	39.9 (NCH_3), 53.3 (OCH_3), 53.9 (SO_2CH_2), 127.2 ($o/m\text{-C}_{\text{Ar}}$), 128.1 ($p\text{-C}_{\text{Ar}}$), 129.6 ($m/o\text{-C}_{\text{Ar}}$), 140.7 ($ipso\text{-C}_{\text{Ar}}$), 164.0 (CO)	243 $[\text{M}]^+$ (71), 106 (100), 104 (15), 79 (21), 77 (38), 42 (15)
2c	2.41 (3H, c, CCH_3); 3.82 (3H, c, OCH_3); 4.08 (2H, c, SO_2CH_2); 6.79 (1H, c, NH); 7.15–7.28 (3H, м, ArH); 7.51 (1H, д, $J = 7.3$, ArH)	18.0 (CCH_3), 53.3 (OCH_3), 54.1 (SO_2CH_2), 123.0 ($\text{C}_{\text{Ar}}\text{H}$), 126.7 ($\text{C}_{\text{Ar}}\text{H}$), 127.3 ($\text{C}_{\text{Ar}}\text{H}$), 131.5 ($\text{C}_{\text{Ar}}\text{H}$), 132.2 (C_{Ar}), 134.4 (C_{Ar}), 164.3 (CO)	243 $[\text{M}]^+$ (12), 106 (100), 79 (10), 77 (19)
2d	2.35 (3H, c, CCH_3); 3.84 (3H, c, OCH_3); 3.95 (2H, c, SO_2CH_2); 6.91 (1H, c, NH); 7.17–7.25 (4H, м, ArH)	21.0 (CCH_3), 52.7 (SO_2CH_2), 53.4 (OCH_3), 123.1 (2,6- C_{Ar}), 130.3 (3,5- C_{Ar}), 133.4 (1/4- C_{Ar}), 136.6 (4/1- C_{Ar}), 164.6 (CO)	243 $[\text{M}]^+$ (27), 211 (12), 106 (100), 79 (28), 77 (32)
2e	2.42 (6H, c, 2 CH_3); 3.85 (3H, c, OCH_3); 4.20 (2H, c, SO_2CH_2); 6.68 (1H, c, NH); 7.08–7.17 (3H, м, ArH)	19.2 (CCH_3), 53.3 (OCH_3), 57.7 (SO_2CH_2), 128.2 (4- C_{Ar}), 128.9 (3,5- C_{Ar}), 132.5 (1- C_{Ar}), 137.7 (2,6- C_{Ar}), 164.8 (CO)	257 $[\text{M}]^+$ (8), 120 (100), 91 (12)
2f	3.82 (3H, c, OCH_3); 3.98 (2H, c, SO_2CH_2); 7.26 (1H, c, NH); 7.27–7.36 (4H, м, ArH)	53.0 (SO_2CH_2), 53.5 (OCH_3), 124.0 (2,6- C_{Ar}), 129.9 (3,5- C_{Ar}), 132.2 (1/4- C_{Ar}), 134.7 (4/1- C_{Ar}), 164.4 (CO)	263 $[\text{M}]^+$ (21), 231 (28), 126 (100), 99 (50)
2g	3.85 (3H, c, OCH_3); 4.03 (2H, c, SO_2CH_2); 7.24–7.27 (4H, м, ArH)	53.6 (SO_2CH_2), 53.7 (OCH_3), 120.2 (2,6- C_{Ar}), 126.4 (4- C_{Ar}), 136.1 (3,5- C_{Ar}), 138.2 (1- C_{Ar}), 164.3 (CO)	297 $[\text{M}]^+$ (100), 265 (92), 223 (22), 187 (58), 160 (50), 133 (78), 104 (32), 90 (20), 63 (36), 45 (23)
2h	3.82 (3H, c, OCH_3); 3.85 (3H, c, OCH_3); 3.93 (2H, c, SO_2CH_2); 6.87 (1H, c, NH); 6.91 (2H, д, $J = 8.7$, 3,5-ArH); 7.30 (2H, д, $J = 8.7$, 2,6-ArH)	52.6 (SO_2CH_2), 53.4 (OCH_3), 55.6 (OCH_3), 114.9 (3,5- C_{Ar}), 125.6 (2,6- C_{Ar}), 128.6 (1- C_{Ar}), 158.6 (4- C_{Ar}), 164.6 (CO)	259 $[\text{M}]^+$ (10), 122 (100), 95 (16)
2i	1.40 (3H, т, $J = 7.0$, CH_2CH_3); 3.81 (3H, c, OCH_3); 4.0 (2H, c, SO_2CH_2); 4.38 (2H, к, $J = 7$, CH_2CH_3); 7.37 (2H, д, $J = 8.7$, 2,6-ArH); 7.47 (1H, c, NH); 8.06 (2H, д, $J = 8.7$, 3,5-ArH)	14.4 (CH_2CH_3), 53.5 (OCH_3), 53.62 (SO_2CH_2), 61.3 (OCH_2), 120.5 (2,6- C_{Ar}), 127.9 (4- C_{Ar}), 131.4 (3,5- C_{Ar}), 140.5 (1- C_{Ar}), 164.1 (CO), 165.9 (CO)	301 $[\text{M}]^+$ (100), 256 (48), 241 (48), 182 (57), 163 (90), 119 (38), 108 (95), 91 (50), 64 (33), 42 (17)
2j	1.30 (3H, т, $J = 7.3$, CH_2CH_3); 3.89 (2H, c, SO_2CH_2); 4.23 (2H, к, $J = 7.3$, CH_2CH_3); 4.36 (2H, д, $J = 6.5$, NCH_2); 5.30 (1H, т, $J = 6.5$, NH); 7.30–7.41 (5H, м, ArH)	14.1 (CH_2CH_3), 47.9 (NCH_2), 55.7 (SO_2CH_2), 62.6 (OCH_2), 128.3 ($o/m\text{-C}_{\text{Ar}}$), 128.3 ($p\text{-C}_{\text{Ar}}$), 129.0 ($m/o\text{-C}_{\text{Ar}}$), 136.2 ($ipso\text{-C}_{\text{Ar}}$), 164.2 (CO)	106 (100), 91 (40), 88 (10), 77 (22), 60 (16), 51 (15), 42 (17)

Для выяснения границ применимости реакции был изучен набор сульфамидов **2a,c-i** и несколько 1,ω-дигалогеналканов. В результате выяснилось, что в случае сульфанилидов данная реакция весьма чувствительна к электронным эффектам заместителей. Акцепторные группы сильно замедляют процесс, и для его завершения необходимо длительное перемешивание при более высокой температуре, чем в случае сульфида **2a**. По-видимому, это связано с уменьшением нуклеофильности образующегося аниона. Донорные заместители в бензольном кольце, наоборот, способствуют протеканию реакции: так сульфанилиды **2d,h** реагируют быстрее, чем сульфанилид **2a**.

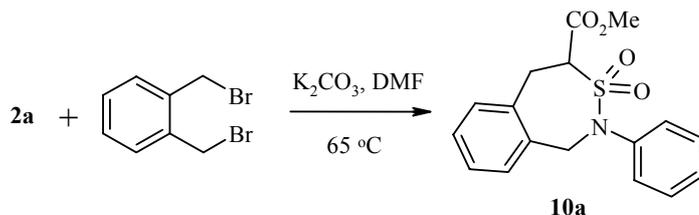
Вместе с тем обнаружено, что заместители в *орто*-положении не препятствуют данной реакции, а в случае сульфида **2e** реакция идет наиболее быстро и с максимальным выходом. Возможное объяснение состоит в том, что в данном случае за счет потери части степеней свободы проигрыш системы в энтропии в результате реакции меньше, чем в случае других сульфамидов, что аналогично хорошо известному *гем*-диалкильному эффекту в реакциях циклизации [9]. Высокая стерическая перегруженность продуктов циклоалкилирования сульфида **2e** всеми тремя α,ω-дигалогеналканами подтверждается, судя по спектрам ЯМР, диастереотопностью С-метильных групп.

Т а б л и ц а 3

Сульфамиды

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	Выход, %
		С	Н	N		
4a	C ₁₁ H ₁₃ NO ₄ S	<u>51.69</u>	<u>5.15</u>	<u>5.56</u>	96–97	70
		51.75	5.13	5.56		
4c	C ₁₂ H ₁₅ NO ₄ S	<u>53.40</u>	<u>5.62</u>	<u>5.07</u>	69–70	68
		53.52	5.61	5.20		
4d	C ₁₂ H ₁₅ NO ₄ S	<u>53.43</u>	<u>5.54</u>	<u>5.18</u>	99–100	76
		53.52	5.61	5.20		
4e	C ₁₃ H ₁₇ NO ₄ S	<u>55.19</u>	<u>6.11</u>	<u>4.89</u>	107–108	86
		55.12	6.05	4.94		
4f	C ₁₁ H ₁₂ ClNO ₄ S	<u>45.48</u>	<u>4.12</u>	<u>4.89</u>	121–122	56
		45.60	4.17	4.83		
4h	C ₁₂ H ₁₅ NO ₅ S	<u>50.58</u>	<u>5.26</u>	<u>4.93</u>	125–126	74
		50.53	5.26	4.91		
4i	C ₁₄ H ₁₇ NO ₆ S	<u>51.48</u>	<u>5.31</u>	<u>4.12</u>	143–144	18
		51.37	5.23	4.28		
4j	C ₁₃ H ₁₇ NO ₄ S				–	1.5
6a	C ₁₂ H ₁₅ NO ₄ S	<u>53.40</u>	<u>5.60</u>	<u>5.20</u>	59–60	73
		53.52	5.61	5.20		
6e	C ₁₄ H ₁₉ NO ₄ S	<u>56.46</u>	<u>6.44</u>	<u>4.72</u>	172–174	84
		56.55	6.44	4.71		
7e	C ₁₅ H ₂₁ NO ₄ S	<u>57.86</u>	<u>6.91</u>	<u>4.45</u>	127–128	27
		57.86	6.80	4.50		
10a	C ₁₇ H ₁₇ NO ₄ S	<u>61.48</u>	<u>5.31</u>	<u>4.27</u>	137–138	53
		61.61	5.17	4.23		

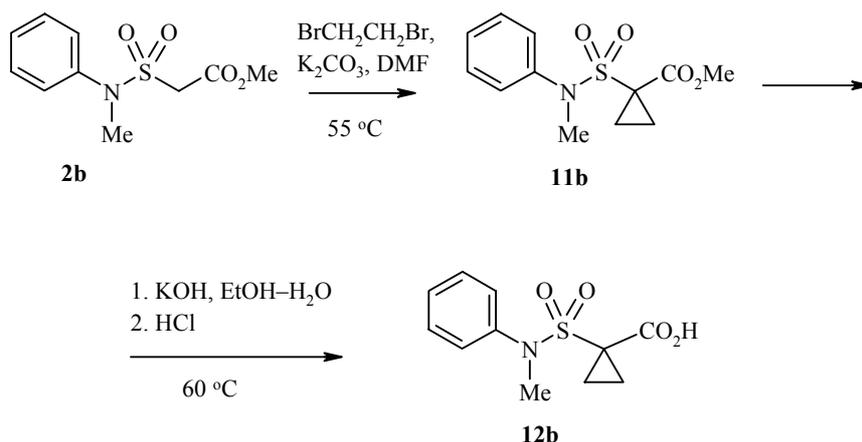
многокомпонентная смесь, разделить которую не удалось. Данный результат довольно логичен, так как скорость образования семичленных циклов намного ниже таковой для пяти- и шестичленных. Однако при использовании стерически более жесткого алкилирующего агента вероятность внутримолекулярной реакции возрастает. Так при алкилирование сульфамида **2a** 1,2-бис(бромметил)бензолом удалось выделить 4-метоксикарбонил-3,3-диокси-2-фенил-1,2,4,5-тетрагидробензо[*d*][1,2]тиазепин (**10a**) с выходом 53%.



В спектре ЯМР ^1H (но не ^{13}C) данного соединения наблюдается сильное уширение сигналов протонов семичленного цикла, что свидетельствует о наличии конформационного перехода вблизи комнатной температуры коалесценции.

Все полученные сульфаматы **4–7** содержат сложноэфирную группу, которая в мягких условиях может быть гидролизована с образованием соответствующих кислот **5a**, **8a** без декарбоксилирования последних, что открывает возможность дальнейшей функционализации по карбоксильной группе.

Для третичного сульфамида **2b** показана возможность получения производного циклопропана **11b** с высоким выходом.



Полученный эфир **11b** легко гидролизуется до соответствующей кислоты **12b**, причем при кипячении последней в течение 15 ч в N_2N -диметилацетамиде декарбоксилирования не происходит.

Спектры ЯМР ^1H , ^{13}C и масс-спектры сультамов

Соединение	ЯМР ^1H (CDCl_3), δ , м. д. (J , Гц)	ЯМР ^{13}C (CDCl_3), δ , м. д.	Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %)
4a	2.67 (1H, м, H-4); 2.90 (1H, м, H-4'); 3.76 (1H, д. т., $J = 6.9$ и $J = 8.7$, H-3); 3.91 (3H, с, OCH_3); 3.93 (1H, м, H-3'); 4.30 (1H, д. д., $J = 6.9$ и $J = 8.7$, H-5); 7.20–7.42 (5H, м, ArH)	22.1 (C-4), 45.4 (C-3), 53.8 (OCH_3), 62.0 (C-5), 121.2 ($o\text{-C}_{\text{Ar}}$), 125.7 ($p\text{-C}_{\text{Ar}}$), 129.5 ($m\text{-C}_{\text{Ar}}$), 137.2 ($ipso\text{-C}_{\text{Ar}}$), 165.0 (CO)	255 $[\text{M}]^+$ (38), 160 (12), 132 (100), 104 (83), 77 (81), 51 (29), 39 (18)
4c	2.39 (3H, с, CCH_3); 2.68 (1H, м, H-4); 2.89 (1H, м, H-4'); 3.65 (1H, д. т., $J = 5.5$ и $J = 8.7$, H-3); 3.79 (1H, д. т., $J = 5.8$ и $J = 8.7$, H-3'); 3.91 (3H, с, OCH_3); 4.26 (1H, д. д., $J = 5.5$ и $J = 8.4$, H-5); 7.24–7.43 (4H, м, ArH)	18.0 (CCH_3), 22.6 (C-4), 47.6 (C-3), 53.7 (OCH_3), 60.8 (C-5), 127.2 (C_{ArH}), 128.7 (C_{ArH}), 129.0 (C_{ArH}), 131.5 (C_{ArH}), 134.7 (C_{Ar}), 139.1 (C_{Ar}), 165.8 (CO)	269 $[\text{M}]^+$ (12), 146 (51), 118 (100), 91 (35), 65 (22), 55 (18), 39 (17)
4d	2.35 (3H, с, CCH_3); 2.64 (1H, м, H-4); 2.88 (1H, м, H-4'); 3.73 (1H, д. т., $J = 6.9$ и $J = 8.7$, H-3); 3.86 (1H, м, H-3'); 3.96 (3H, с, OCH_3); 4.26 (1H, д. д., $J = 5.5$ и $J = 8.4$, H-5); 7.17–7.23 (4H, м, ArH)	21.0 (CCH_3), 22.2 (C-4), 45.8 (C-3), 53.8 (OCH_3), 61.8 (C-5), 122.3 ($\text{C}_{\text{Ar-2,6}}$), 130.2 ($\text{C}_{\text{Ar-3,5}}$), 134.4 ($\text{C}_{\text{Ar-1/4}}$), 136.1 ($\text{C}_{\text{Ar-4/1}}$), 165.2 (CO)	269 $[\text{M}]^+$ (32), 146 (60), 130 (10), 119 (100), 91 (82), 77 (12), 65 (40), 55 (32), 39 (29)
4e	2.38 (3H, с, CCH_3); 2.41 (3H, с, CCH_3); 2.73 (1H, м, H-4); 2.93 (1H, м, H-4'); 3.60 (1H, д. т., $J = 5.8$ и $J = 8.7$, H-3); 3.90 (1H, д. т., $J = 5.8$ и $J = 8.7$, H-3'); 3.90 (3H, с, OCH_3); 4.22 (1H, т., $J = 7.62$, H-5); 7.09–7.20 (3H, м, ArH)	18.4 (CCH_3), 18.6 (CCH_3), 22.5 (C-4), 45.3 (C-3), 53.5 (OCH_3), 60.6 (C-5), 129.1 ($\text{C}_{\text{Ar-3,5}}$), 129.2 ($\text{C}_{\text{Ar-4}}$), 132.3 ($\text{C}_{\text{Ar-1}}$), 139.8 ($\text{C}_{\text{Ar-2/6}}$), 140.6 ($\text{C}_{\text{Ar-6/2}}$), 165.3 (CO)	283 $[\text{M}]^+$ (12), 204 (22), 160 (31), 132 (100), 117 (30), 105 (20), 91 (12), 77 (21), 55 (22), 39 (18).
4f	2.67 (1H, м, H-4); 2.82 (1H, м, H-4'); 3.72 (1H, м, H-3); 3.91 (3H, с, OCH_3); 3.82 (1H, м, H-3'); 4.29 (1H, т., $J = 7.3$, H-5); 7.23–7.37 (4H, м, ArH)	22.1 (C-4), 45.5 (C-3), 53.9 (OCH_3), 61.9 (C-5), 122.7 ($\text{C}_{\text{Ar-2,6}}$), 129.7 ($\text{C}_{\text{Ar-3,5}}$), 131.4 ($\text{C}_{\text{Ar-1/4}}$), 135.8 ($\text{C}_{\text{Ar-4/1}}$), 164.9 (CO)	289 $[\text{M}]^+$ (15), 166 (62), 139 (100), 111 (62), 75 (40), 55 (40), 39 (20)
4h	2.63 (1H, м, H-4); 2.73 (1H, м, H-4'); 3.69 (1H, м, H-3); 3.81 (3H, с, OCH_3); 3.82 (1H, м, H-3'); 3.90 (3H, с, OCH_3); 4.27 (1H, д. д., $J = 6.5$ и $J = 8.7$, H-5); 6.89–6.95 (2H, м, 3,5-ArH); 7.25–7.30 (2H, м, 2,6-ArH)	22.3 (C-4), 46.6 (C-3), 53.7 (OCH_3), 55.6 (OCH_3), 61.4 (C-5), 114.9 ($\text{C}_{\text{Ar-3,5}}$), 125.8 ($\text{C}_{\text{Ar-2,6}}$), 129.4 ($\text{C}_{\text{Ar-1}}$), 158.6 ($\text{C}_{\text{Ar-4}}$), 165.4 (CO)	285 $[\text{M}]^+$ (18), 162 (25), 135 (100), 120 (63), 92 (23), 65 (15), 55 (24), 39 (28)

4i	1.39 (3H, т, $J = 6.9$, OCH ₂ CH ₃); 2.70 (1H, м, H-4); 2.86 (1H, м, $J = 6.5$ и $J = 7.3$, H-4'); 3.78 (1H, м, H-3); 3.89 (3H, с, OCH ₃); 3.97 (1H, м, H-3'); 4.28–4.39 (3H, м); 7.27 (1H, д, $J = 8.0$, 2,6-ArH); 8.04 (1H, д, $J = 8.0$, 3,5-ArH)	14.5 (CH ₂ CH ₃), 22.0 (C-4), 44.9 (C-3), 53.9 (OCH ₃), 61.1 (OCH ₂), 62.4 (C-5), 118.1 (C _{Ar} -2,6), 126.4 (C _{Ar} -4), 131.1 (C _{Ar} -3,5), 141.6 (C _{Ar} -1), 164.6 (CO), 166.1 (CO)	327 [M] ⁺ (18), 218 (14), 204 (54), 174 (55), 149 (18), 132 (100), 104 (26), 77 (52), 64 (20), 55 (32)
4j	1.36 (3H, т, $J = 6.9$, OCH ₂ CH ₃); 2.43 (1H, м, H-4); 2.67 (1H, м, H-4'); 3.10 (1H, д. д. д, $J = 5.8$, $J = 8.0$ и $J = 9.5$, H-3); 3.23 (1H, д. д. д, $J = 5.8$, $J = 8.0$ и $J = 9.5$, H-3'); 4.11 (1H, д. д, $J = 5.8$ и $J = 8.7$, H-5); 4.18 (1H, д, $J = 14.5$, C _{Ar} CHH'); 4.26 (1H, д, $J = 14.5$, C _{Ar} CHH'); 4.27–4.42 (2H, м); 7.30–7.33 (5H, м, ArH)	14.0 (CH ₂ CH ₃), 22.2 (C-4), 44.2 (CH ₂), 49.1 (CH ₂), 60.9 (C-5), 62.6 (OCH ₂), 128.0 (<i>p</i> -C _{Ar}), 128.4 (<i>o/m</i> -C _{Ar}), 128.7 (<i>m/o</i> -C _{Ar}), 135.3 (<i>ipso</i> -C _{Ar}), 165.0 (CO)	262 [M-1] ⁺ (11), 206 (24), 146 (15), 119 (12), 91 (100)
6a	1.95 (1H, м); 2.10 (1H, м); 2.59 (2H, м); 3.74 (1H, д. т, $J = 4.5$ и $J = 13.8$, H-3); 3.82 (3H, с, OCH ₃); 3.95–4.01 (1H, м); 4.08 (1H, д. д, $J = 4.4$ и $J = 9.6$, H-6); 7.27–7.40 (5H, м, ArH)	23.0 (CH ₂), 28.0 (CH ₂), 53.3 (C-3), 53.3 (OCH ₃), 63.7 (C-6), 126.8 (<i>o/m</i> -C _{Ar}), 127.4 (<i>p</i> -C _{Ar}), 129.2 (<i>m/o</i> -C _{Ar}), 140.7 (<i>ipso</i> -C _{Ar}), 165.7 (CO)	269 [M] ⁺ (50), 146 (52), 119 (100), 105 (90), 91 (30), 77 (86), 64 (18), 55 (28), 51 (49), 39 (42)
6e	1.96–2.03 (2H, м); 2.41 (3H, с, CCH ₃); 2.42 (3H, с, CCH ₃); 2.50–2.72 (2H, м); 3.33 (1H, д, $J = 13.1$, H-3); 3.85 (3H, с, OCH ₃); 4.04 (1H, м, H-3'); 4.16 (1H, д. д, $J = 4.0$ и $J = 11.4$, H-6); 7.06–7.14 (3H, м, ArH)	19.4 (CCH ₃), 20.1 (CCH ₃), 24.7 (CH ₂), 28.3 (CH ₂), 52.2 (C-3), 53.3 (OCH ₃), 65.0 (C-6), 128.4 (C _{Ar} -3/4/5), 128.7 (C _{Ar} -4/5/3), 129.3 (C _{Ar} -5/3/4), 138.0 (C _{Ar} -1/2/6), 138.8 (C _{Ar} -2/6/1), 138.9 (C _{Ar} -6/1/2), 165.6 (CO)	297 [M] ⁺ (7), 218 (25), 174 (100), 132 (65), 117 (19), 105 (21), 91 (11), 77 (22), 55 (16), 39 (22)
7e	1.73–1.83 (1H, м); 2.06–2.37 (5H, м); 2.41 (3H, с, CCH ₃); 2.47 (3H, с, CCH ₃); 2.98 (1H, д. т, $J = 5.8$ и $J = 12.1$); 3.64 (1H, д. д. д, $J = 2.8$, $J = 5.3$ и $J = 12.1$); 3.80 (3H, с, OCH ₃); 4.15 (1H, д. д, $J = 4.6$ и $J = 11.1$, H-7); 7.07–7.15 (3H, м, ArH)	19.2 (CCH ₃), 19.8 (CCH ₃), 25.3 (CH ₂), 27.7 (CH ₂), 28.8 (CH ₂), 50.6 (C-3), 53.2 (OCH ₃), 71.7 (C-7), 128.5 (3/4/5-C _{Ar}), 129.2 (4/5/3-C _{Ar}), 129.5 (5/3/4-C _{Ar}), 136.4 (1-C _{Ar}), 139.6 (C _{Ar} -2,6), 166.8 (CO)	311 [M] ⁺ (6), 280 (11), 247 (14), 188 (39), 177 (16), 132 (100), 105 (16), 77 (16), 39 (16)
10a	3.47 (1H, д, $J = 15.3$, H-5); 3.78 (4H, м); 4.08 (1H, д, $J = 10.9$, H-4); 4.38 (1H, ш. с, H-1); 5.18 (1H, ш. с, H-1'); 6.80 (2H, д, $J = 10.9$, ArH); 7.02 (1H, д, $J = 10.9$, ArH); 7.20–7.40 (6H, м, ArH)	34.6 (C-5), 53.4 (OCH ₃), 55.9 (C-1), 67.0 (C-4), 128.2 (C _{Ar} H), 128.5 (C _{Ar} H), 129.0 (2C _{Ar} H), 129.3 (3C _{Ar} H), 130.2 (C _{Ar} H), 131.4 (C _{Ar} H), 136.7 (C _{Ar}), 138.4 (C _{Ar}), 139.8 (C _{Ar}), 166.0 (CO)	331 [M] ⁺ (10), 206 (27), 116 (100), 104 (24), 93 (59), 77 (79), 64 (23), 59 (26), 51 (47), 39 (32)

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ^1H и ^{13}C снимали на приборе Bruker DPX 300 (300 и 75 МГц соответственно) в CDCl_3 . Химические сдвиги определяли относительно сигнала растворителя в спектрах ЯМР ^1H : 7.26 (для CHCl_3) и 2.49 м. д. (для DMCO-d_5); в спектрах ЯМР ^{13}C : 77.1 (для CDCl_3), 39.5 (для DMCO-d_6) и 204.1 м. д. (для ацетона- d_6). КССВ в протонных спектрах измеряли в приближении первого порядка. Для определения мультиплетности сигналов в спектрах ЯМР ^{13}C использовали стандартную импульсную последовательность DEPT-135. Масс-спектры получали на приборе Finnigan MAT Incos 50, ионизация электронным ударом (EI) с энергией ионизирующих электронов 70 эВ. Элементные анализы выполняли на автоматическом CHN-анализаторе Hewlett Packard HP-185B. Степень протекания реакций, значения R_f и чистоту продуктов контролировали методом ТСХ на пластинах ALUGRAM[®] SIL G/UV₂₅₄, элюент – этилацетат–гексан, 1 : 2, если не указано иное.

Метоксикарбонилметансульфохлорид (1a). Выход 77%, т. кип. 115–116 °С (15 мм рт. ст.) [10].

Этоксикарбонилметансульфохлорид (1b). Выход 72%, т. кип. 124–126 °С (15 мм рт. ст.) [11].

Синтез метоксикарбонилметансульфониламидов 2a–i (общая методика). К перемешиваемому раствору 110 ммоль ариламина и 8.69 г (110 ммоль) пиридина в 70 мл ацетонитрила при 15–20 °С медленно добавляют 17.25 г (100 ммоль) эфира **1a**, растворенного в 30 мл ацетонитрила, после чего реакционную смесь нагревают до 35 °С и выдерживают при этой температуре 15 мин. Разбавляют при перемешивании 600 мл воды и подкисляют конц. HCl до $\text{pH} \leq 2$. Выпавший осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из смеси диэтилового эфира и гексана.

4'-Метокси(метоксикарбонил)метансульфанилид (2h) синтезирован ранее [3], но не охарактеризован.

N-Бензил(этоксикарбонил)метансульфамид (2j). К раствору 9.3 г (50 ммоль) сульфохлорида **1b** в 100 мл диэтилового эфира при перемешивании и охлаждении прибавляют по каплям смесь 5.35 г (50 ммоль) бензиламина и 5.05 г (50 ммоль) N-метилморфолина в 50 мл эфира таким образом, чтобы температура не превышала 2 °С, после этого реакционную массу разбавляют 150 мл воды и подкисляют конц. HCl до $\text{pH} \leq 2$. Эфирный слой отделяют, водный экстрагируют дихлорметаном (2×30 мл). Органические фазы объединяют, высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из диэтилового эфира. Выход 60%, т. пл. 56–57 °С.

N-Бензил(метоксикарбонил)метансульфанилид (2k). К смеси 0.92 г (4 ммоль) сульфамида **2a** и 0.83 г (6 ммоль) поташа в 40 мл ДМФА добавляют 0.5 г (4 ммоль) бензилхлорида. Реакционную смесь перемешивают в течение 1 ч при 20 °С, после чего нагревают до 40 °С и перемешивают еще 1 ч, далее разбавляют 100 мл воды, подкисляют до $\text{pH} \leq 2$ и экстрагируют дихлорметаном (3×50 мл). Органический слой промывают 2% HCl (5×80 мл), высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт выделяют хроматографией на силикагеле (элюент этилацетат–гексан 1 : 2, R_f 0.4). Выход 24%, светло-желтое масло. Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 3.88 (3H, с, OCH_3); 4.05 (2H, с, SO_2CH_2); 4.94 (2H, с, NCH_2); 7.22–7.41 (10H, м, ArH). Спектр ЯМР ^{13}C , δ , м. д.: 53.2 (OCH_3), 54.5 (CH_2), 57.0 (CH_2), 127.9 (C_{ArH}), 128.5 (C_{ArH}), 128.5 (C_{ArH}), 128.6 (C_{ArH}), 129.5 (C_{ArH}), 129.5 (C_{ArH}), 136.3 (C_{Ar}), 138.3 (C_{Ar}), 164.2 (CO). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 319 $[\text{M}]^+$ (8), 181 (18), 104 (12), 91 (100), 84 (30), 77 (25), 51 (11). Аналитически чистый образец получить не удалось.

N-Аллил(метоксикарбонил)метансульфанилид (2l). К смеси 0.92 г (4 ммоль) сульфида **2a** и 0.83 г (6 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА при 55 °С в течение 1.5 ч при перемешивании добавляют 0.48 г (4 ммоль) аллилбромида. Продукт выделяют аналогично сульфамиду **2k**. Выход 68%, бурое масло. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д. (*J*, Гц): 3.83 (3H, с, OCH₃); 3.99 (2H, с, SO₂CH₂); 4.36 (2H, д, *J* = 6.5, NCH₂); 5.09–5.16 (2H, м, CH=CH₂); 5.80 (1H, д. д. т, *J* = 6.5, *J* = 10.2 и *J* = 16.7, CH=CH₂); 7.34–7.47 (5H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 53.2 (OCH₃), 54.6 (CH₂), 55.6 (CH₂), 119.0 (CH=CH₂), 128.5 (*p*-C_{Ar}), 129.3 (*o/m*-C_{Ar}), 129.5 (*m/o*-C_{Ar}), 133.1 (CH=CH₂), 138.4 (*ipso*-C_{Ar}), 164.0 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 269 [M]⁺ (24), 238 (10), 132 (100), 117 (51), 104 (79), 91 (35), 77 (94), 65 (16), 57 (18), 51 (32). Аналитически чистый образец получить не удалось.

Метил-2-(N-бензил-N-фениламиносульфонил)-3-фенилпропионат (3a) получают аналогично сульфамиду **2k**, *R_f* 0.3. Выход 16%, т. пл. 115–116 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д. (*J*, Гц): 3.38 (1H, д. д, *J* = 12.8 и *J* = 13.7, СНСНН'), 3.50 (1H, д. д, *J* = 4.7 и *J* = 13.7, СНСНН'), 3.75 (3H, с, OCH₃), 4.29 (1H, д. д, *J* = 4.7 и *J* = 12.8, СНСН₂), 4.72 (1H, д, *J* = 14.5, NCHН'), 4.96 (1H, д, *J* = 14.5, NCHН'), 7.16–7.27 (15H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 33.8 (CHСН₂), 53.1 (OCH₃), 57.1 (NCH₂), 68.5 (СНСН₂), 127.4 (C_{Ar}Н), 128.0 (C_{Ar}Н), 128.4 (C_{Ar}Н), 128.5 (C_{Ar}Н), 128.8 (C_{Ar}Н), 128.9 (C_{Ar}Н), 129.0 (C_{Ar}Н), 129.4 (C_{Ar}Н), 129.6 (C_{Ar}Н), 136.1 (C_{Ar}), 136.1 (C_{Ar}), 138.4 (C_{Ar}), 166.4 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 409 [M]⁺ (1), 182 (31), 131 (11), 121 (22), 104 (18), 91 (100), 77 (40), 65 (11), 51 (11). Найдено, %: С 67.44; Н 5.72; N 3.25. C₂₃H₂₃NO₆S. Вычислено, %: С 67.46; Н 5.66; N 3.42.

Синтез сультамов 4a,c-f,h-j (общая методика). К смеси 4 ммоль соответствующего сульфида **2a,c-f,h-j** и 1.66 г (12 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА добавляют в течение 1.5 ч при 55–75 °С раствор 0.9 г (4.8 ммоль) 1,2-дибромэтана в 40 мл ДМФА и перемешивают до окончания реакции (контроль методом ТСХ). Затем реакционную смесь разбавляют 150 мл воды, подкисляют конц. HCl до pH ≤ 2 и экстрагируют дихлорметаном (3×50 мл). Органическую фазу промывают 2% HCl (5×80 мл), высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из смеси диэтилового эфира и гексана.

Метил-1,1-диоксо-2-(4-этоксикарбонилфенил)-1,2-тиазолидин-5-карбоксилат (4i) выделяют хроматографией на силикагеле, *R_f* 0.25.

Этил-2-бензил-1,1-диоксо-1,2-тиазолидин-5-карбоксилат (4j) выделяют хроматографией на силикагеле, масло, *R_f* 0.35. Аналитически чистый образец получить не удалось.

1,1-Диоксо-2-фенил-1,2-тиазолидин-5-карбоновая кислота (5a). К раствору 1.02 г (4 ммоль) сульфида **4a** в 50 мл 50% водного метанола прибавляют 2.7 г (4.8 ммоль) 10% раствора KOH и перемешивают 0.5 ч. Добавляют 100 мл воды и отгоняют метанол в вакууме при 30 °С на роторном испарителе. После этого к водному раствору добавляют 70 мл этилацетата и аккуратно подкисляют 3% HCl до pH ≤ 2. Органический слой отделяют, водный экстрагируют этилацетатом (2×30 мл). Органические фазы объединяют, высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из смеси диэтилового эфира и гексана. Выход 92%, т. пл. 137–138 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д. (*J*, Гц): 2.54–2.73 (2H, м, Н-4); 3.72–3.82 (2H, м, Н-3); 4.47 (1H, т, *J* = 8.4, Н-5); 7.14–7.36 (5H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 21.6 (С-4), 44.4 (С-3), 62.4 (С-5), 119.4 (*o*-C_{Ar}), 124.0 (*p*-C_{Ar}), 128.9 (*m*-C_{Ar}), 137.8 (*ipso*-C_{Ar}), 164.9 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 241 [M]⁺ (31), 132 (58), 105 (100), 77 (65), 51 (20). Найдено, %: С 49.64; Н 4.61; N 6.08. C₁₀H₁₁NO₄S. Вычислено, %: С 49.78; Н 4.60; N 5.81.

Синтез сультамов 6a,e (общая методика). К смеси 4 ммоль сульфида (**2a** или **2e**) и 1.66 г (12 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА при 60 °С в течение 1.5 ч добавляют раствор 0.75 г (4.8 ммоль) 1-бром-3-хлорпропана в 60 мл ДМФА. После этого реакционную смесь продолжают перемешивать до окончания реакции (контроль методом ТСХ). Реакционную смесь обрабатывают так же, как и в случае сультамов **4a–**

f.

Метил-2-(2,6-диметилфенил)-1,1-диоксо-1,2-тиазепан-7-карбоксилат (7e).

К смеси 1.03 г (4 ммоль) сульфида **2e** и 1.66 г (12 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА добавляют в течение 1.5 ч при 70 °С раствор 0.91 г (4.2 ммоль) 1,4-дибромбутана в 60 мл ДМФА и перемешивают реакционную смесь в течение 100 ч. Разбавляют 150 мл воды, подкисляют конц. HCl до pH ≤ 2 и экстрагируют дихлорметаном (3×50 мл). Органическую фазу промывают 2% HCl (5×80 мл), высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из смеси этилацетат–гексан.

1,1-Диоксо-2-фенил-1,2-тиазинан-6-карбоновая кислота (8a). Получают аналогично соединению **5a**. Выход 94%, т. пл. 141–142 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д. (*J*, Гц): 1.96 (2H, м, H-4); 2.40 (2H, м, H-5); 3.45 (1H, м, H-3); 3.91 (1H, м, H-3'); 4.15 (1H, т, *J* = 7.3, H-6); 7.24–7.40 (5H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 22.5 (CH₂), 27.6 (CH₂), 52.8 (C-3), 63.6 (C-6), 126.5 (*p*-C_{Ar}), 126.6 (*o/m*-C_{Ar}), 128.6 (*m/o*-C_{Ar}), 140.8 (*ipso*-C_{Ar}), 165.7 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 255 [M]⁺ (13), 146 (50), 119 (50), 104 (58), 91 (25), 77 (100), 65 (17), 50 (40), 39 (40). Найдено, %: C 51.75; H 4.95; N 5.87. C₁₀H₁₁NO₄S. Вычислено, %: C 51.75; H 5.13; N 5.49.

(N-Бензиламиносульфонил)уксусная кислота (9j). К раствору 0.26 г (1 ммоль) сульфида **2j** и 0.21 г (0.96 ммоль) дибромэтана в 20 мл ТГФ добавляют порциями 100 мг (2.5 ммоль, 60% дисперсия в масле) NaN в течение 0.5 ч. После этого реакционную смесь упаривают досуха в вакууме на роторном испарителе при 30 °С. К остатку добавляют 30 мл диэтилового эфира и 50 мл 5% соляной кислоты. Органический слой отделяют, водный экстрагируют этилацетатом (2×25 мл). Органические фазы объединяют, высушивают сульфатом натрия и упаривают. Продукт перекристаллизовывают из смеси этилацетата и гексана. Выход 92%, т. пл. 155–156 °С. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д. (*J*, Гц): 4.05 (2H, с, SO₂CH₂); 4.19 (2H, д, *J* = 6.5, NCH₂); 7.24–7.35 (5H, м, ArH); 7.93 (1H, т, *J* = 6.5, NH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 46.4 (NHCH₂), 56.9 (SO₂CH₂), 126.9 (*p*-C_{Ar}), 127.6 (*o/m*-C_{Ar}), 128.0 (*m/o*-C_{Ar}), 137.9 (*ipso*-C_{Ar}), 164.6 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 229 [M]⁺ (5), 210 (10), 106 (100), 91 (50), 77 (18). Найдено, %: C 47.32; H 5.02; N 6.16. C₉H₁₁NO₄S. Вычислено, %: C 47.15; H 4.84; N 6.11.

4-Метоксикарбонил-3,3-диоксо-2-фенил-1,2,4,5-тетрагидробензо[d][1,2]-тиазепин (10a). К смеси 0.91 г (4 ммоль) сульфида **2a** и 1.66 г (12 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА добавляют в течение 2 ч при 65 °С раствор 1.58 г (6 ммоль) 1,2-бис(бромметил)бензола в 40 мл ДМФА и перемешивают до окончания реакции (контроль методом ТСХ). Смесь разбавляют 150 мл воды, подкисляют конц. HCl до pH ≤ 2 и экстрагируют дихлорметаном (3×50 мл). Органические фазы объединяют, промывают 2% HCl (5×80 мл) и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из этилацетата.

Метил-1-(N-метил-N-фениламиносульфонил)циклопропанкарбоксилат (11b). К смеси 1.94 г (8 ммоль) сульфида **2b** и 3.31 г (24 ммоль) поташа в 60 мл ДМФА добавляют в течение 2 ч при 65 °С раствор 1.65 г (7.7 ммоль) 1,2-дибромэтана в 40 мл ДМФА и перемешивают еще 24 ч. Затем реакционную смесь разбавляют 150 мл воды, подкисляют конц. HCl до pH ≤ 2 и экстрагируют дихлорметаном (3×50 мл). Органические фазы объединяют, промывают 2% HCl (5×80 мл), высушивают над сульфатом натрия и упаривают досуха. Выход 72%, светло-желтое масло. Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д.: 1.45 (4H, м, CH₂CH₂); 3.51 (3H, с, NCH₃), 3.79 (3H, с, OCH₃); 7.30–7.40 (5H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C, δ, м. д.: 17.11 (CH₂CH₂), 40.70 (NCH₃), 40.96 (SO₂C), 53.00 (OCH₃), 127.67 (*o/m*-C_{Ar}), 127.79 (*p*-C_{Ar}), 129.35 (*m/o*-C_{Ar}), 141.48 (*ipso*-C_{Ar}), 168.27 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 269 [M]⁺ (12), 106 (100), 77 (53), 51 (12), 39 (25). Найдено, %: C 53.70; H 5.62; N 5.26. C₁₂H₁₅NO₄S. Вычислено, %: C 53.52; H 5.61; N 5.20.

1-(N-Метил-N-фениламиносульфонил)циклопропанкарбоновая кислота (12b). К кипящему раствору 1.07 г (4 ммоль) эфира **8b** в 20 мл 50% водного этанола

добавляют 2.8 г 10% раствора КОН (5 ммоль). Раствор нагревают еще 10 мин, охлаждают до комнатной температуры, разбавляют 100 мл воды и подкисляют HCl до pH ≤ 2. Полученную суспензию экстрагируют этилацетатом (3×50 мл), органические фазы объединяют, высушивают сульфатом натрия и упаривают досуха. Продукт перекристаллизовывают из смеси гексан–этилацетат. Выход 86%, т. пл. 150–151 °С. Спектр ЯМР ¹H (DMCO-d₆), δ, м. д.: 1.24 (4H, м, CH₂CH₂); 3.43 (3H, с, NCH₃); 7.27–7.37 (5H, м, ArH). Спектр ЯМР ¹³C (ацетон-d₆), δ, м. д.: 14.4 (CH₂CH₂), 38.6 (NCH₃), 39.0 (SO₂C), 125.9 (*p*-C_{Ar}), 126.1 (*o/m*-C_{Ar}), 127.6 (*m/o*-C_{Ar}), 140.4 (*ipso*-C_{Ar}), 167.0 (CO). Масс-спектр, *m/z* (*I*_{отн.}, %): 255 [M]⁺ (32), 106 (100), 79 (21), 77 (62), 51 (12), 39 (44). Найдено, %: С 51.70; Н 5.22; N 5.56. С₁₁H₁₃NO₄S. Вычислено, %: С 51.75; Н 5.13; N 5.49.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. М. Д. Машковский, *Лекарственные средства*, Медицина, Москва, 1986, т. 2.
2. А. Т. Солдатенков, Н. М. Колядина, И. В. Шендрик, *Основы органической химии лекарственных веществ*, Химия, Москва, 2001.
3. S.-U. Kang, W. J. Choi, S. Oishi, K. K. Lee, R. G. Karki, K. M. Worthy, L. K. Bindu, M. C. Nicklaus, R. J. Fisher, T. R. Burke, Jr., *J. Med. Chem.*, **50**, 1978 (2007).
4. A. Thorarensen, B. D. Wakefield, D. L. Romero, K. R. Marotti, M. T. Sweeney, G. E. Zurenko, D. C. Rohrer, F. Han, G. L. Bryant, *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, **17**, 2823 (2007).
5. B. Love, M. Kormendy, K. M. Snader, *Synthesis*, **31**, 3531 (1966).
6. S. Rossi, G. Pagani, *Ann. Chim. (Rome)*, **56**, 728 (1966).
7. D. D. Long, A. P. Termin, *Tetrahedron Lett.*, **41**, 6743 (2000).
8. J. E. Oliver, A. B. DeMilo, *Synthesis*, 321 (1975).
9. N. L. Allinger, W. Zalkow, *J. Org. Chem.*, **25**, 701 (1960).
10. M. J. Szymonifka, J. V. Heck, *Tetrahedron Lett.*, **30**, 2869 (1989).
11. A. Berre, A. Etienne, B. Desmazieres, *Bull. Soc. Chim. Fr.*, 807 (1975).

Санкт-Петербургский государственный университет,
Санкт-Петербург 198504, Россия
e-mail: vsokolo@mail.ru

Поступило 08.10.2007