

А. В. Задорожний, В. А. Ковтуненко, А. В. Туров, Т. Т. Кучеренко

## КОНДЕНСИРОВАННЫЕ ИЗОХИНОЛИНЫ

### 32\*. СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ

#### 4Н-ТИЕНО[3',2':5,6]- И -[2',3':5,6]ПИРИМИДО[1,2-*b*]ИЗОХИНОЛИНОВ И 6,12-ДИГИДРО-5Н-ИЗОХИНО[2,3-*a*]ХИНАЗОЛИН-5,12-ДИОНА

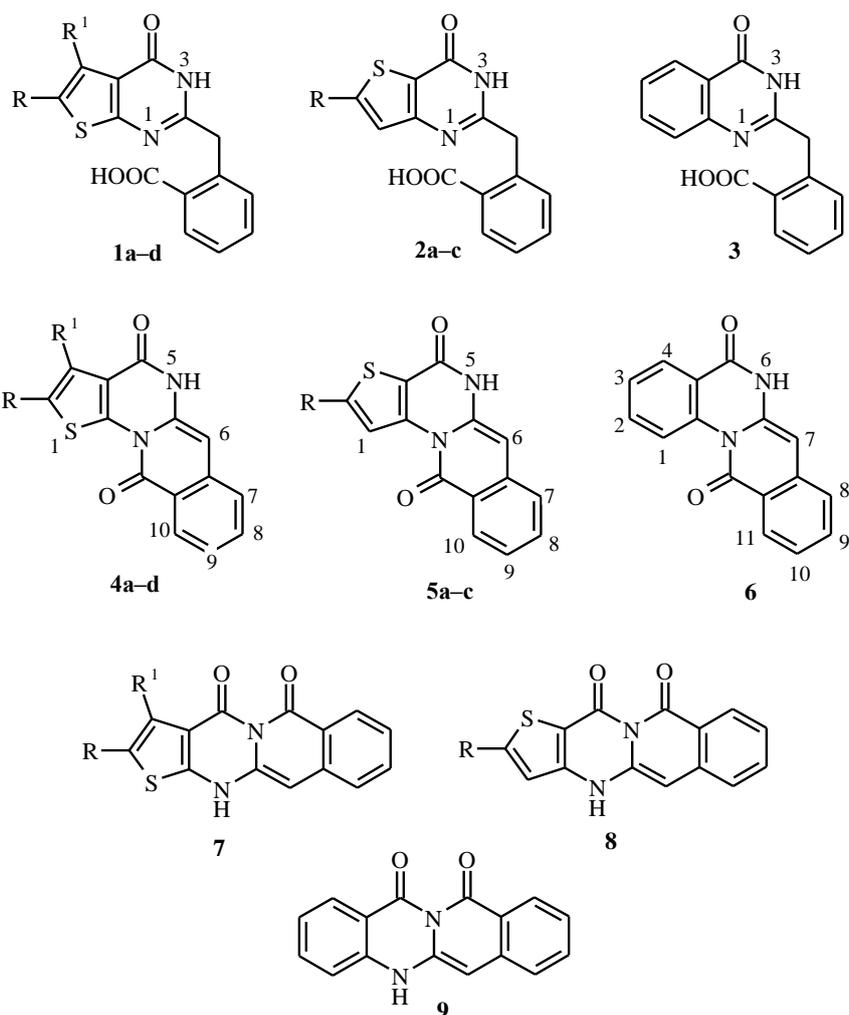
Обработкой 2-(4-оксо-3,4-дигидротиено[2,3-*d*]- и -[3,2-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойных кислот и 2-(4-оксо-3,4-дигидро-2-хиназолинилметил)бензойной кислоты уксусным ангидридом получены тиено[3',2':5,6]- и -[2',3':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11-дионы и изохино[2,3-*a*]хиназолин-5,12-дион соответственно. С помощью спектроскопии ЯМР показано, что внутримолекулярное ацилирование упомянутых кислот проходит по атому N-1 пиримидиноновой части бицикла.

**Ключевые слова:** изохинохиназолин-5,12-дион, 4-оксопиримидиноны, тиенопиримидиноны, тиенопиримидоизохинолин-4,11-дионы, хиназолонны.

Ранее нами были описаны 2-(4-оксо-3,4-дигидротиено[2,3-*d*]- и -[3,2-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойные кислоты **1** и **2** [2] и 2-(4-оксо-3,4-дигидро-2-хиназолинилметил)бензойная кислота **3** [3]. Настоящая работа продолжает наши исследования в области тиенопиримидинов и хиназолонов.

Кислоты **1–3** при попытке эстерификации классическим методом [4] (нагревание спиртовой суспензии в присутствии концентрированной серной кислоты) образуют желтые кристаллические вещества, которые по своим свойствам отличаются от исходных веществ и в то же время не являются сложными эфирами. Например, подобно исходным кислотам они растворяются в 2 н. растворе щелочи, но в отличие от них вовсе нерастворимы в 2 н. соляной кислоте. Их хроматографическая подвижность, по данным ТСХ, существенно выше, чем у исходных кислот и сложных эфиров. Данные элементного анализа и хромато-масс-спектры полученных веществ указывают на потерю молекулы воды исходными кислотами, т. е. в условиях реакции произошло внутримолекулярное ацилирование. Оказалось, что первоначально использованная нами в качестве водоотнимающего средства серная кислота – не совсем подходящий реагент, поскольку циклизация сопровождается энергичным осмолением продукта реакции, которое существенно снижает выходы. Более гладко дегидратация происходит при кипячении суспензии кислот **1–3** в уксусном ангидриде.

\* Сообщение 31 см. [1].



**4 a** R = R<sup>1</sup> = Me; **b** R+R<sup>1</sup> = (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>; **c** R+R<sup>1</sup> = (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>; **d** R = H, R<sup>1</sup> = Ph;  
**5 a** R = H; **b** R = 4'-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; **c** R = 4'-FC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>

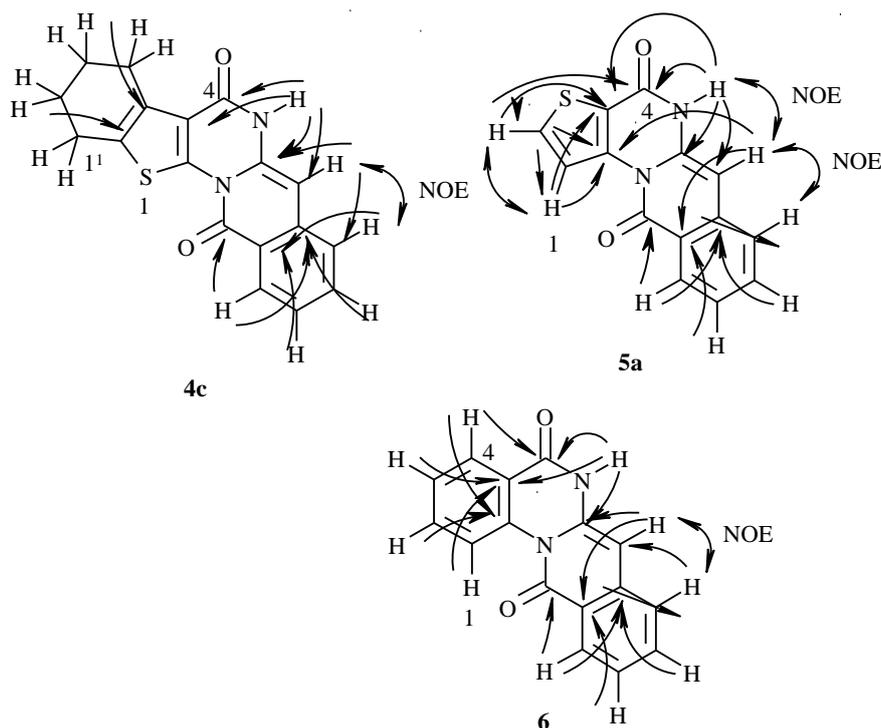
Кислоты 4-оксотиено[2,3-*d*]- и -[3,2-*d*]пиримидинового (**1** и **2**), а также 4-оксохиназолинового (**3**) рядов имеют два нуклеофильных центра атаки: атомы N-1 и N-3. Внутримолекулярная циклизация с участием этих центров может привести к ангулярным (**4–6**) или линейным (**7–9**) тетрациклическим системам. Но как из наших исследований по алкилированию сложных эфиров кислот **1–3** [3, 4], так и из литературных данных по алкилированию [5] и ацилированию [6] 2-бензилпроизводных тиенопиримидиновых и хиназолиновых систем следует, что в данных реакциях принимает участие исключительно атом N-3. Исходя из этих предположений, следовало бы ожидать, что полученные системы имеют линейные структуры **7–9**.

В то же время квантово-химические расчеты энергий изомерных ангулярных и линейных систем **4** и **7**, **5** и **8**, а также соответствующих изохинохиназолиндионов **6** и **9**, выполненные с помощью компьютерной

программы [7] в рамках метода *ab initio*, в базисе 3-21G\*\* (с учетом *d*-орбиталей) и полной оптимизацией геометрии, составляют для молекулы **4a** –792188.67, а для **7** –792170.65 ккал·моль<sup>-1</sup>. У позиционного изомера **5a** она равна –743454.73, а у линейной молекулы **8** –743437.23 ккал·моль<sup>-1</sup>. Для молекулы **6** –543176.13, а для ее линейного изомера **9** –543165.97 ккал·моль<sup>-1</sup>. Таким образом, вопреки литературным данным расчеты предсказывают внутримолекулярную циклизацию по атому N-1 кислот (**1**, **2** и **3**) как термодинамически выгодный процесс. Заслуживает быть отмеченным значительно меньшее различие полных энергий линейных и ангулярных изомеров у молекул **6** и **9** по сравнению с парами производных тиафена **4–7**, **5–8**.

Аналогичные выводы о направлении циклизации по атому N-1 кислот **1**, **2** и **3** следуют из данных ЯМР для соединений **4** (или **7**), **5** (или **8**) а также **6** (или **9**). Линейные либо ангулярные изомеры, образующиеся при циклизации, содержат одинаковые структурные фрагменты и поэтому прямое определение их структур на основании спектров на ядрах <sup>1</sup>H либо <sup>13</sup>C не представляется возможным. Поэтому мы провели изучение двумерных спектров ЯМР с гомоядерной (COSY, NOESY) и гетероядерной <sup>1</sup>H–<sup>13</sup>C корреляциями через одну (HMQC) и через 2–3 связи (HMBC).

Прежде всего, потребовалось отнести сигналы в спектрах ЯМР <sup>1</sup>H соединений. В основу определения строения соединения **4** (или **7**) положено выяснение пространственной близости протона NH к ароматическим протонам, а также дальних корреляций сигнала NH протона с атомами углерода скелета молекулы. Мы приводим (см. рисунок) результаты анализа и его объяснение только для соединения **4c**, поскольку для всех остальных соединений ряда **4** они являются подобными. Рассмотрение формул **4** и **7** показывает, что единственным их существенным структурным различием является взаимное расположение протона NH и атомов углерода карбонильных групп. Если в структуре **4** между протоном NH и одним из карбонильных атомов углерода имеется 2 химические связи, то в структуре **7** их разделяют 4 связи. Поскольку атомы углерода карбонильных групп в спектре на ядрах <sup>13</sup>C имеют достаточно характерное расположение, то наличие спин-спинового взаимодействия (ССВ) между сигналами протонов NH и атомом углерода одной из карбонильных групп однозначно свидетельствует в пользу структуры **4**. В табл. 1 приведены корреляции для сигналов протонов соединения **4c**. Найденные корреляции (см. рисунок) позволили надежно отнести сигналы и сделать выбор между альтернативными структурами в пользу структуры **4**. Наличие корреляции дублета ароматического протона с химическим сдвигом 8.14 м. д. с сигналом одного из карбонильных атомов углерода, который резонирует при 158.6 м. д., дает возможность отнести данный сигнал так, как это показано на рисунке. Сигнал NH коррелирует с сигналом второго имеющегося в молекуле карбонила, который резонирует при 156.8 м. д. Наличие данной корреляции надежно подтверждает структуру соединения. На рисунке стрелками показаны корреляции HMBC. Сигналы атомов углерода, связанные с атомами водорода, отнесены на основании корреляций в спектре HMQC. Единственный углеродный сигнал, для которого HMBC-корреляции



Пример корреляции НМҚС и НМВС для соединения **4с**, **5а** и **6**

не обнаружены, имеет химический сдвиг 141.5 м. д. Мы отнесли его к узловому атому углерода, расположенному между гетероциклическими атомами азота и серы. При отнесении сигналов циклогексенового фрагмента было принято, что сигнал метиленовых протонов, сближенный в пространстве с карбонильной группой, поглощает в несколько более слабом поле, чем сигналы остальных алифатических протонов.

Выводы о строении соединений ряда **5** (либо **8**) базируются на выяснении пространственной близости протона NH с ароматическими протонами, с одной стороны, а, с другой – на выяснении дальних корреляций сигнала NH с атомами углерода скелета молекулы. В статье анализируются корреляции только для соединения **5а** ввиду того, что таковые являются идентичными и для всех остальных соединений ряда (табл. 2). Рассмотрение формул изомеров показывает, что в случае линейного изомера **8** следует ожидать пространственной близости протона NH с двумя ароматическими протонами, а в случае ангулярного изомера **5а** – только с одним. Из экспериментальных данных следует, что имеется кросс-пик в спектре NOESY между сигналом протона NH и сигналом при 6.27 м. д. Другие кросс-пики для данного сигнала не обнаружены и это свидетельствует в пользу ангулярного строения соединения, т. е. **5а**. Дальнейшее подтверждение этому следует из данных по гетероядерной корреляции (см. рисунок). Отнесения химических сдвигов атомов углерода, связанных с атомами водорода, сделаны на основании корреляций НМҚС, а отнесение четвертичных атомов углерода – на основании имеющихся корреляций НМВС. Наиболее важным, с точки

Таблица 1

**Результаты экспериментов по гетероядерной корреляции (HMBC и HMQC)  
для соединения 4с**

Положение атома	$\delta$ , м. д.	HMQC	HMBC
5	11.71	–	156.8; 137.6; 118.2; 86.5
10	8.14	128.1	158.6; 137.3; 134.0
8	7.63	134.0	137.3; 128.1
7	7.51	125.6	137.3; 124.7; 118.8; 86.5
9	7.31	124.7	125.6; 118.8
6	6.26	86.5	137.6; 141.5; 125.6; 118.8
3(4')	2.82	25.4	132.9; 130.6; 23.0; 22.5
2(1')	2.65	24.0	132.9; 130.6; 23.0; 22.5
2', 3'	1.73	23.0; 22.5	132.9; 130.6; 25.4; 24.0; 23.0; 22.5

Таблица 2

**Результаты экспериментов по гомоядерной (спектр NOESY) и гетероядерной  
корреляции (HMBC и HMQC) для соединения 5а**

Положение атома	$\delta$ , м. д.	HMQC	HMBC	NOESY
5	12.03	–	138.8; 120.6; 155.6; 82.7	6.27
1	8.68	123.9	141.7; 133.8; 120.6	8.17
10	8.21	128.3	137.1; 133.8; 159.9	–
2	8.17	133.8	141.7; 123.9; 120.6; 155.6	8.68
8	7.65	133.9	137.1; 128.3	7.54; 7.33
7	7.53	125.3	124.7; 120.6; 87.2	7.65
9	7.33	124.7	125.2; 120.6	7.65; 8.21
6	6.27	87.2	141.7; 138.8; 125.3; 120.6	12.03; 7.54

Таблица 3

**Результаты экспериментов по гетероядерной корреляции (HMBC и HMQC)  
для соединения 6**

Положение атома	$\delta$ , м. д.	HMQC	HMBC
6	11.86	–	119.9; 137.8; 158.4
1	9.22	121.6	158.4; 138.7; 126.8; 119.9
11	8.17	128.7	162.7; 136.9; 134.1
4	8.09	127.5	158.4; 138.7; 134.2
2	7.75	134.2	138.7; 127.5; 121.6
9	7.61	134.1	136.9; 128.7
3	7.46	126.8	121.6; 119.9
8	7.45	125.1	136.9; 125.0; 122.2; 87.7
10	7.30	125.0	125.1; 122.2; 136.9; 134.1; 128.7
7	6.18	87.7	137.8; 125.1; 122.2

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  соединений 4–6

Со- еди- не- ние	Химические сдвиги, $\delta$ , м. д. (J, Гц)									
	Позиция резонирующей группы (атома)									
	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
<b>4a</b>	–	2.41 (3H, c)	2.36 (3H, c)	–	11.71 (1H, c)	6.30 (1H, c)	7.50 (1H, д, $^3J = 8.0$ )	7.62 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	7.32 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	8.22 (1H, д, $^3J = 8.4$ )
<b>4b</b>	–	2.99–2.93 (6H, м)		–	11.83 (1H, c)	6.34 (1H, c)	7.53 (1H, д, $^3J = 8.0$ )	7.65 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	7.35 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	8.24 (1H, д, $^3J = 8.0$ )
<b>4c</b>	–	1.90–1.80 (4H, м); 2.77–2.75 (2H, м); 2.93–2.91 (2H, м)		–	11.71 (1H, c)	6.26 (1H, c)	7.51 (1H, д, $^3J = 7.6$ )	7.63 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	7.31 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	8.14 (1H, д, $^3J = 8.0$ )
<b>4d</b>	–	9.00 (1H, c)	7.78 (2H-2', д, $J = 8.0$ ); 7.51 (3H-3', 4', м)	–	12.00 (1H, c)	6.28 (1H, c)	7.51 (1H, м)	7.64 (1H, т, $^3J = 7.6$ )	7.33 (1H, т, $J = 7.6$ )	8.24 (1H, д, $^3J = 8.0$ )
<b>5a</b>	8.68 (1H, д, $^3J = 5.2$ )	8.17 (1H, д, $^3J = 5.2$ )	–	–	12.03 (1H, c)	6.27 (1H, c)	7.47 (1H, д, $^3J = 7.6$ )	7.65 (1H, т, ) $^3J = 8.0$ )	7.33 (1H, т, $^3J = 8.0$ )	8.21 (1H, д, $^3J = 8.0$ )
<b>5b</b>	8.97 (1H, c)	7.77 (2H-3', c) 7.51 (2H-2', c)	–	–	12.04 (1H, c)	6.26 (1H, c)	7.51 (1H, м)	7.63 (1H, c)	7.32 (1H, c)	8.19 (1H, c)
<b>5c</b>	8.92 (1H, c)	7.80 (2H-3', м); 7.33–7.29 (2H-2', м)	–	–	12.03 (1H, c)	6.26 (1H, c)	7.49 (1H, д, $^3J = 6.4$ )	7.63 (1H, т, $^3J = 6.0$ )	7.33–7.29 (1H, м)	8.19 (1H, д, $^3J = 6.4$ )
<b>6*</b>	9.24 (1H, д, $^3J = 7.2$ )	7.74 (1H, т, $^3J = 6.8$ )	7.48 (2H, м)	8.10 (1H, д, $^3J = 6.0$ )	11.87 (1H, c) {6}	6.20 (1H, c) {7}	7.48 (2H, м) {8}	7.63 (1H, т, $^3J = 5.6$ ) {9}	7.32 (1H, т, $^3J = 5.6$ ) {10}	8.19 (1H, д, $^3J = 6.4$ ) {11}

\* Порядковые номера атомов в молекуле, согласно принятой номенклатуре, приведены в { }.

зрения установления структуры соединения, является отсутствие корреляции между сигналом протона NH и сигналом атома углерода с химическим сдвигом 123.9 м. д., отвечающим атому С-4 тиафенового цикла. В альтернативной линейной структуре данная корреляция должна была бы быть достаточно интенсивной.

При определении строения соединения **6** (либо **9**) трудности возникают из-за того, что спиновые системы двух входящих в состав молекулы бензольных колец являются одинаковыми. Отнесение можно осуществить с помощью сравнения имеющихся корреляций в спектрах COSY и NOESY. Ключом к отнесению сигналов является наличие ЯЭО между синглетом протона Н-7, который поглощает при 6.18, и дублетом при 7.45 м. д. Поскольку отнесение синглета сомнений не вызывает, то ЯЭО для него может наблюдаться только для сигнала ближайшего к нему протона Н-8. Далее все остальные сигналы данной спиновой системы можно отнести на основании корреляций COSY. Сигналы протонов второго бензольного кольца можно отнести, если считать, что протону, сближенному с карбонильным атомом кислорода, соответствует химический сдвиг 9.22 м. д. Тогда отнесение остальных сигналов спиновой системы следует из корреляций COSY. Уже имеющиеся данные свидетельствуют о том, что изучаемой молекуле соответствует структура **6**. Это следует из того, что сигнал протона Н-1 расположен в аномально слабом поле вследствие пространственной близости с неподеленной электронной парой карбонильного атома кислорода (в альтернативной структуре **9** такой ситуации не возникает). Кроме того, сигнал протона NH имеет COSY-корреляцию только с одним сигналом ароматических протонов. В случае структуры **9** таких корреляций должно было бы быть две. Дополнительное подтверждение строения **6** для данного продукта было получено на основании гетерогенных корреляций. В табл. 3 приведены корреляции НМQC и НМBC, найденные для сигналов протонов синтезированного гетероцикла. Важнейшим доказательством в пользу углового строения молекулы **6** является корреляция сигнала протона группы NH, поглощающего при 11.86 м. д. с атомом углерода одной из карбонильных групп, расположенным при 158.4 м. д. В случае, если бы молекула имела альтернативное строение **9**, такая корреляция была бы невозможной, поскольку карбонильные атомы углерода в ней удалены от NH более чем на 3 химические связи. На рисунке приведены отнесения всех углеродных сигналов и стрелками показаны важнейшие корреляции НМBC, которые послужили основанием для отнесений. Отнесение сигналов узловых атомов углерода основывалось на наличии корреляций с сигналами протонов, находящихся по отношению к ним в *мета*-положении. Сигнал узлового атома углерода, расположенного между гетероциклическими атомами азота отнесен на основании наличия корреляций с синглетом при 6.18 м. д. и с сигналом протона NH. Сигналы атомов углерода, связанных с атомами водорода, отнесены на основании наличия корреляций в спектре НМQC со связанными с ними протонами.

В табл. 4 приведены данные спектров ЯМР  $^1\text{H}$  для всех синтезированных соединений **4–6**.

## ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР  $^1\text{H}$  и  $^{13}\text{C}$  соединений **4–6**, эксперименты по ЯЭО и двумерной спектроскопии ЯМР  $^1\text{H}$  COSY, а также гетероядерные корреляционные спектры НМРС и НМВС зарегистрированы на спектрометре Varian Mercury-400 (400 и 100 МГц соответственно). Все двумерные эксперименты проводились с градиентной селекцией полезных сигналов. Время смешивания в импульсных последовательностях соответствовало  $^1J_{\text{CH}} = 140$  и  $^{2-3}J_{\text{CH}} = 8$  Гц. Количество инкрементов в спектрах COSY и НМРС составило 128, а в спектрах НМВС – 400. Во всех случаях растворитель  $\text{DMCO-d}_6$ , внутренний стандарт ТМС.

Масс-спектры измерены на масс-спектрометре Agilent 1100 Series, с селективным детектором Agilent LC/MSD SL, образец вводится в матрице трифторуксусной кислоты, ионизация ЭУ, приведены числовые значения  $m/z$  ( $I_{\text{отн.}}$ , %).  $[\text{M}^+ + 1]$  – пик молекулярного иона. Температуры плавления синтезированных веществ измерены в пирексовых капиллярах в приборе Тиле и не подвергались коррекции. ТСХ проводилась на пластинках Merck 60 F254, элюент смесь бензол–метанол, 9 : 1. Продукты **4–6** имеют  $R_f$  0.90–0.92. У сложных эфиров  $R_f$  0.65–0.68, а у исходных кислот **1–3** –  $R_f$  0.25–0.28.

**2,3-Диметил-4Н-тиено[3',2':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11(5Н)-дион (4а).** К 0.31 г (10 ммоль) 2-(5,6-диметил-4-оксо-3,4-дигидро-тиено[2,3-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойной кислоты (**1а**) прибавляют 10 мл (106 ммоль) уксусного ангидрида и кипятят с обратным холодильником при перемешивании 4 ч. Осадок отфильтровывают и промывают диэтиловым эфиром. Выход 90%, т. пл. 325 °С (из ДМФА). Масс-спектр,  $m/z$ : 297  $[\text{M}^+ + 1]$ . Найдено, %: С 64.80; Н 4.00; N 9.39; S 10.78.  $\text{C}_{16}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 64.85; Н 4.08; N 9.45; S 10.82.

**2,3-Дигидро-1Н,4Н-циклопента[4',5']тиено[3',2':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11(5Н)-дион (4б)** получают аналогично из 0.33 г (10 ммоль) 2-(4-оксо-3,5,6,7-тетрагидро-4Н-циклопента[4,5]тиено[2,3-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойной кислоты (**1б**). Выход 92%, т. пл. 305 °С (из ДМФА). Масс-спектр,  $m/z$ : 309  $[\text{M}^+ + 1]$ . Найдено, %: С 66.12; Н 3.86; N 8.96; S 10.35.  $\text{C}_{17}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 66.22; Н 3.92; N 9.08; S 10.40.

**8,9,10,11-Тетрагидро-7Н-бензо[1]тиено[3',2':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,14(6Н)-дион (4с)** получают аналогично из 0.34 г (10 ммоль) 2-(4-оксо-3,4,5,6,7,8-гексагидробензо[4,5]тиено[2,3-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойной кислоты (**1с**). Выход 93%, т. пл. 325 °С (из ДМФА). Масс-спектр,  $m/z$ : 323  $[\text{M}^+ + 1]$ . Найдено, %: С 66.95; Н 4.31; N 8.57; S 9.86.  $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 67.06; Н 4.38; N 8.69; S 9.95.

**3-Фенил-4Н-тиено[3',2':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11(5Н)-дион (4д)** получают аналогично из 0.36 г (10 ммоль) 2-(4-оксо-5-фенил-3,4-дигидро-тиено[2,3-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойной кислоты (**1д**). Выход 90%, т. пл. 300 °С (из ДМФА). Масс-спектр,  $m/z$ : 345  $[\text{M}^+ + 1]$ . Найдено, %: С 69.72; Н 3.46; N 8.05; S 9.25.  $\text{C}_{20}\text{H}_{12}\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 69.75; Н 3.51; N 8.13; S 9.31.

**4Н-Тиено[2',3':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11(5Н)-дион (5а)** получают аналогично из 0.29 г (10 ммоль) 2-(4-оксо-3,4-дигидро-тиено[3,2-*d*]пиримидин-2-илметил)бензойной кислоты (**2а**) в 10 мл (106 ммоль) уксусного ангидрида. Выход 92%, т. пл. 290 °С (из НОАс). Масс-спектр,  $m/z$ : 269  $[\text{M}^+ + 1]$ . Найдено, %: С 62.72; Н 3.09; N 10.52; S 11.84.  $\text{C}_{14}\text{H}_8\text{N}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 62.68; Н 3.01; N 10.44; S 11.95.

**2-(4-Хлорфенил)-4Н-тиено[2',3':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11(5Н)-дион (5б)** получают аналогично из 0.40 г (10 ммоль) 2-[6-(4-хлорфенил)-4-оксо-3,4-дигидро-тиено[3,2-*d*]пиримидин-2-илметил]бензойной кислоты (**2б**). Выход 90%, т. пл. 320 °С (из ДМФА). Найдено, %: С 63.32; Н 2.90; N 7.43; S 8.38.  $\text{C}_{20}\text{H}_{11}\text{ClN}_2\text{O}_2\text{S}$ . Вычислено, %: С 63.41; Н 2.93; N 7.39; S 8.46.

**2-(4-Фторфенил)-4Н-тиено[2',3':5,6]пиримидо[1,2-*b*]изохинолин-4,11-(5Н)-дион (5с)** получают аналогично из 0.38 г (10 ммоль) 2-[6-(4-фторфенил)-4-оксо-3,4-дигидротиено[3,2-*d*]пиримидин-2-илметил]бензойной кислоты (**2с**). Выход 93%, т. пл. 300 °С (из ДМФА). Масс-спектр, *m/z*: 363 [ $M^+ + 1$ ]. Найдено, %: С 66.11; Н 3.11; N 7.65; S 8.93.  $C_{20}H_{11}FN_2O_2S$ . Вычислено, %: С 66.29; Н 3.06; N 7.73; S 8.85.

**5Н-Изохино[2,3-*a*]хиназолин-5,12(6Н)-дион (6)** получают аналогично из 0.28 г (10 ммоль) 2-[(4-оксо-3,4-дигидро-2-хиназолинил)метил]бензойной кислоты (**3**) в 10 мл (106 ммоль) уксусного ангидрида. Выход 90%, т. пл. 305 °С (из НОАс). Масс-спектр, *m/z*: 263 [ $M^+ + 1$ ]. Найдено, %: С 73.16; Н 3.76; N 10.60.  $C_{16}H_{10}N_2O_2$ . Вычислено, %: С 73.27; Н 3.84; N 10.68.

*Авторы благодарят фирму "Енамин" (г. Киев) за поддержку проекта.*

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Л. М. Потиха, В. М. Кисиль, А. В. Туров, В. А. Ковтуненко, *ХГС*, 1044 (2008)
2. Т. Т. Кучеренко, А. В. Задорожний, В. А. Ковтуненко, *ХГС*, 940 (2008).
3. В. А. Ковтуненко, Т. Т. Кучеренко, О. В. Шишкин, В. М. Кисель, *ХГС*, 1408 (2002). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **38**, 1242 (2002)].
4. *Органикум*, Мир, Москва, 1992, т. 2, с. 84.
5. Н. Hosni, W. Basyouni, *Acta Pol. Pharm.*, **56**, 49 (1999).
6. Н. Hosni, W. Basyouni, *J. Chem. Res. Miniprint.*, **11**, 2775 (1999).
7. HyperChem Professional 5.1; Hypercube©Inc. 2002 [предоставлена проф. О. Д. Качковским (ИОХ НАН Украины, г. Киев)].

*Киевский национальный университет  
им. Тараса Шевченко, Киев 01033, Украина  
e-mail: vkovtunenکو@univ.kiev.ua*

*Поступило 27.07.2007*