

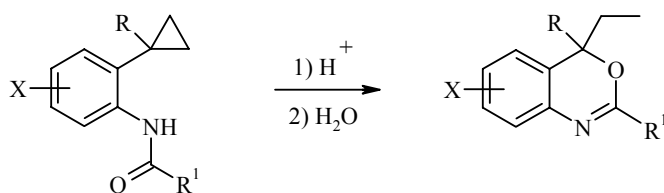
Р. А. Газзаева<sup>а</sup>, М. И. Хасанов, С. С. Мочалов, Н. С. Зефирюв

### 4Н-3,1-БЕНЗОКСАЗИНЫ ИЗ *o*-АМИНОАЦИЛБЕНЗОЛОВ

Предложен новый эффективный метод синтеза 4Н-3,1-бензоксазинов на основе 2-аминоацилбензолов. Найденная последовательность превращений может быть использована как для 2-аминоарилалкилкетонов, так и для 2-аминобензофенонов.

**Ключевые слова:** 2-аминоацилбензолы,  $\alpha$ -(2-N-ациламиноарил)алканолы, 2-N-ациламиноарилалкилкетоны, 2-N-ациламинобензгидролы, 2-N-ациламинобензофеноны, 4Н-3,1-бензоксазины, внутримолекулярная гетероциклизация.

4Н-3,1-Бензоксазины занимают важное место в ряду гетероциклических соединений, среди которых ведется интенсивный поиск лекарственных средств нового поколения [1]. К настоящему времени уже разработан целый ряд синтетических подходов к 4Н-3,1-бензоксазинам, использование которых позволяет синтезировать необходимые для биологических исследований гетероциклы. Однако, если обратиться к примерам синтеза 4Н-3,1-бензоксазинов по известным схемам, то нетрудно видеть, что варибельность заместителей в целевых гетероциклах довольно ограничена. Например, при использовании производных *o*-аминобензилгалогенидов [2] или *o*-аминобензиловых спиртов [3–6] в синтезе 4Н-3,1-бензоксазинов, варьирование заместителей возможно практически лишь на стадии ацилирования по аминогруппе указанных аминов. В результате могут быть получены лишь 3,1-бензоксазины, содержащие различные заместители в положении 2 гетероцикла. Более широкие возможности в плане синтеза различным образом замещенных 4Н-3,1-бензоксазинов открывает найденная совсем недавно перегруппировка 2-ациламинофенилциклопропанов [7].

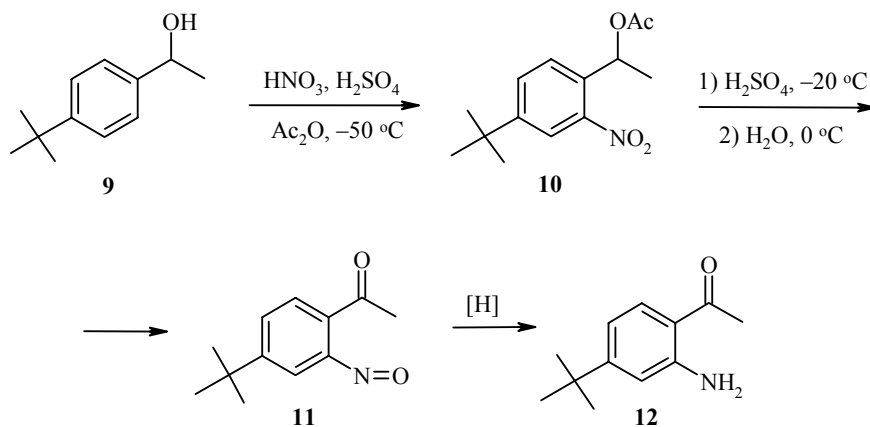


X = Hal, Alk, Ac; R = H, Me; R<sup>1</sup> = Alk, Ar, Het

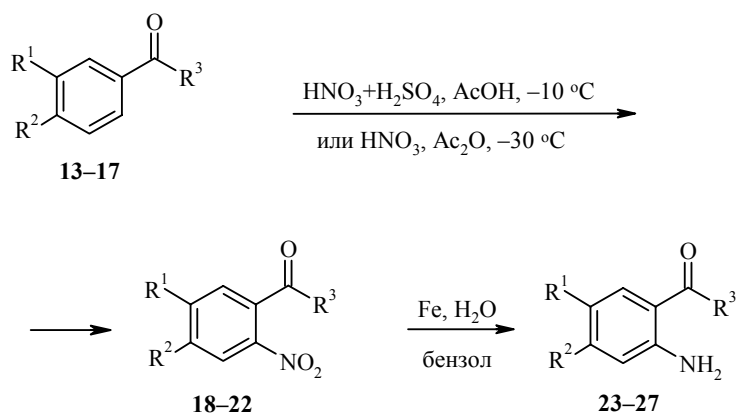
Однако в этом случае при широких возможностях вариации заме-



этанол (9), образуя 2-нитрозо-4-*трет*-бутилацетофенон (11) [11], восстановлением которого нами был впервые синтезирован соответствующий 2-амино-4-*трет*-бутилацетофенон (12).



К числу субстратов, из которых прямым нитрованием с последующим восстановлением могут быть синтезированы *о*-аминоацилбензолы **23–27**, относятся арилалкилкетоны или диарилкетоны **13–17**, содержащие в одном из бензольных колец в положениях 3 и 4 одновременно две алкоксильные группы.



**13, 18, 23**  $\text{R}^1 = \text{R}^2 = \text{OMe}$ ,  $\text{R}^3 = o\text{-ClC}_6\text{H}_4$ ; **14–17, 19–22, 24–27**  $\text{R}^1 + \text{R}^2 = \text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ ,  
**14, 19, 24**  $\text{R}^3 = \text{Et}$ , **15, 20, 25**  $\text{R}^3 = \text{Ph}$ , **16, 21, 26**  $\text{R}^3 = o\text{-ClC}_6\text{H}_4$ , **17, 22, 27**  $\text{R}^3 = p\text{-BrC}_6\text{H}_4$

Характеристики *o*-ациланилидов 28–42

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С*	Спектр ЯМР <sup>1</sup> H, δ, м. д. ( <i>J</i> , Гц)**	Выход, %
		С	Н	Н			
<b>28***</b>	C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> BrNO <sub>2</sub>	<u>57.72</u> 57.85	<u>4.32</u> 4.23	<u>4.26</u> 4.22	101–102	1.15 (3H, т, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.10 (2H, κ, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 7.23 (1H, т, <i>J</i> = 7.6); 7.40–7.75 (5H, м); 8.10 (1H, д, <i>J</i> = 7.7); 8.65 (1H, д, <i>J</i> = 7.7, ArH); 12.85 (1H, с, NHCO)	86
<b>29</b>	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> BrClNO <sub>2</sub>	<u>52.01</u> 52.41	<u>3.31</u> 3.57	<u>3.54</u> 3.82	130–131	1.20 (3H, т, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.06 (2H, κ, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 7.29 (1H, д, д, <i>J</i> = 8.4, <i>J</i> = 2.0); 7.48 (1H, т, <i>J</i> = 8.1); 7.54 (1H, д, д, <i>J</i> = 8.1, <i>J</i> = 2.2); 7.83 (1H, д, <i>J</i> = 8.4); 7.92 (1H, д, <i>J</i> = 8.1); 8.04 (1H, д, <i>J</i> = 2.0); 9.19 (1H, д, <i>J</i> = 2.0, ArH); 12.76 (1H, с, NHCO)	90
<b>30</b>	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> Cl <sub>2</sub> NO <sub>2</sub>	<u>59.22</u> 59.65	<u>3.88</u> 4.07	<u>4.01</u> 4.35	122–123	1.20 (3H, т, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.15 (2H, κ, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 7.45 (2H, м); 7.48 (1H, д, <i>J</i> = 7.7); 7.54 (1H, д, <i>J</i> = 7.7); 7.60 (1H, д, <i>J</i> = 8.6); 7.90 (1H, д, <i>J</i> = 2.6); 8.95 (1H, д, <i>J</i> = 8.6, ArH); 12.70 (1H, с, NHCO)	87
<b>31</b>	C <sub>17</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>2</sub> S	<u>67.42</u> 67.74	<u>6.04</u> 6.35	<u>4.38</u> 4.65	143–144	1.38 (9H, с, <i>t</i> -Bu); 2.66 (3H, с, Ac); 7.19 (2H, м); 7.75 (2H, м); 7.96 (1H, д, <i>J</i> = 8.3); 8.84 (1H, д, <i>J</i> = 1.9, тиенил, ArH); 12.52 (1H, с, NHCO)	92
<b>32</b>	C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> BrClNO <sub>4</sub>	<u>55.22</u> 55.66	<u>3.41</u> 3.61	<u>2.72</u> 2.95	155–156	3.60 (3H, с, CH <sub>3</sub> O); 3.94 (3H, с, CH <sub>3</sub> O); 6.84 (1H, с); 7.46 (1H, т, <i>J</i> = 7.8); 7.51–7.60 (4H, м); 7.84 (1H, д, <i>J</i> = 7.9); 7.90 (1H, д, <i>J</i> = 7.9); 8.01 (1H, с); 8.22 (1H, с, ArH); 12.08 (1H, с, NHCO)	82
<b>33</b>	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> FNO <sub>4</sub>	<u>65.21</u> 65.65	<u>4.71</u> 4.90	<u>4.02</u> 4.25	170–171	1.08 (3H, т, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.04 (2H, κ, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.35 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 7.36–7.44 (2H, м); 7.61–7.68 (2H, м); 7.88 (1H, т, <i>J</i> = 7.6); 8.25 (1H, с, ArH); 12.25 (1H, с, NHCO)	88
<b>34</b>	C <sub>19</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>4</sub>	<u>69.86</u> 70.14	<u>5.61</u> 5.89	<u>4.03</u> 4.31	194–195	1.24 (3H, т, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 2.43 (3H, с, ArCH <sub>3</sub> ); 2.98 (2H, κ, <i>J</i> = 7.2, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.30 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 7.30 (2H, д, д, <i>J</i> = 7.7, <i>J</i> = 2.3); 7.46 (1H, с); 7.96 (2H, д, д, <i>J</i> = 7.7, <i>J</i> = 2.1); 8.58 (1H, с, ArH); 12.30 (1H, с, NHCO)	76

35	C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>4</sub> S	<u>60.22</u> 60.55	<u>4.51</u> 4.76	<u>4.19</u> 4.41	168–169	1.15 (3H, т, $J = 7.2$ , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.05 (2H, κ, $J = 7.2$ , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.29 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 7.25 (1H, д, д, $J = 5.6$ , $J = 3.6$ ), 7.58 (1H, с); 7.75 (1H, д, $J = 3.6$ ); 7.85 (1H, д, $J = 5.6$ ); 8.16 (1H, с, тиенил, ArH); 12.55 (1H, с, NHCO)	76
36	C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>5</sub>	<u>63.36</u> 63.78	<u>4.83</u> 5.02	<u>4.31</u> 4.65	207–208	1.08 (3H, т, $J = 7.2$ , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.09 (2H, κ, $J = 7.2$ , CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.28 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.74 (1H, д, д, $J = 3.6$ , $J = 1.7$ ); 7.26 (1H, д, $J = 1.7$ ); 7.66 (1H, с); 8.05 (1H, д, $J = 3.6$ ); 8.26 (1H, с, фурил, ArH); 12.56 (1H, с, NHCO)	82
37	C <sub>20</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>5</sub>	<u>68.41</u> 68.76	<u>4.01</u> 4.33	<u>3.82</u> 4.01	215–216	4.28 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.70 (1H, д, д, $J = 3.6$ , $J = 1.7$ ); 6.99 (1H, с); 7.20 (1H, д, $J = 1.7$ ); 7.50–7.70 (5H, м); 7.90 (1H, с); 8.00 (1H, д, $J = 3.6$ , фурил, ArH); 11.49 (1H, с, NHCO)	81
38	C <sub>22</sub> H <sub>16</sub> INO <sub>4</sub>	<u>54.12</u> 54.45	<u>3.11</u> 3.32	<u>2.61</u> 2.89	188–189	4.28 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.98 (1H, с); 7.28 (1H, м); 7.46 (2H, м); 7.51 (1H, м); 7.58 (1H, т, $J = 8.0$ ); 7.65 (2H, м); 7.70 (1H, д, $J = 8.0$ ); 7.87–7.98 (2H, м, ArH); 10.83 (1H, с, NHCO)	68
39	C <sub>23</sub> H <sub>18</sub> ClNO <sub>5</sub>	<u>64.88</u> 65.18	<u>3.96</u> 4.28	<u>3.03</u> 3.30	212–214	3.85 (3H, с, CH <sub>3</sub> O); 4.25 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.39 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.78 (1H, с); 7.40–7.70 (8H, м); 8.30 (1H, с, ArH); 12.20 (1H, с, NHCO)	85
40	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> ClINO <sub>4</sub>	<u>50.11</u> 50.84	<u>2.73</u> 2.91	<u>2.51</u> 2.70	219–220	4.25 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.40 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.78 (1H, с); 7.40 (1H, т, $J = 7.9$ ); 7.48–7.62 (4H, м); 7.93 (1H, д, $J = 7.9$ ); 8.01 (1H, д, $J = 7.9$ ); 8.12 (1H, с); 8.24 (1H, с, ArH); 11.98 (1H, с, NHCO)	80
41	C <sub>20</sub> H <sub>14</sub> BrNO <sub>4</sub> S	<u>53.81</u> 54.07	<u>2.95</u> 3.18	<u>2.91</u> 3.15	205–207	4.28 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 7.05 (1H, с); 7.22 (1H, д, д, $J = 4.8$ , $J = 4.0$ ); 7.45–7.73 (4H, м); 7.72 (1H, д, $J = 4.0$ ); 7.87 (1H, д, $J = 4.8$ ); 8.14 (1H, с, ArH, тиенил); 11.86 (1H, с, NHCO)	73
42	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> Br <sub>2</sub> NO <sub>4</sub>	<u>50.54</u> 51.09	<u>2.61</u> 2.92	<u>2.41</u> 2.71	168–170	4.26 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.38 (2H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.95 (1H, с); 7.20 (2H, м); 7.36 (2H, м); 7.52–7.78 (5H, м, ArH); 10.72 (1H, с, NHCO)	89

\* Соединения **28–31, 35, 36** – из этанола; соединения **32–34, 37–42** – из смеси этанол–хлороформ, 2:1.

\*\* Спектры снимали в ДМСО-d<sub>6</sub> (соединения **28, 31–33, 35–40, 42**) и CDCl<sub>3</sub> (соединения **29, 30, 34**).

\*\*\* Значения КССВ для сигналов протонов групп соединений-аналогов **29, 30, 33–36** отвечают значениям КССВ соединения **28**.

Характеристики *o*-ациламинобензиловых спиртов 43–57

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С*	Спектр ЯМР <sup>1</sup> H, δ, м. д. (J, Гц)**	Выход, %
		С	Н	Н			
43	C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> BrNO <sub>2</sub>	<u>57.20</u> 57.50	<u>4.99</u> 4.83	<u>4.20</u> 4.19	98–99	0.90 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.85 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.10 (1H, с, OH); 4.68 (1H, м, CHOH); 7.08 (2H, м); 7.25–7.39 (3H, м); 7.48 (1H, д, J = 8.2, J = 1.6); 7.60 (1H, д, J = 8.1); 8.24 (1H, д, J = 8.1, ArH); 9.50 (1H, с, NHCO)	76
44	C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> BrClNO <sub>2</sub>	<u>52.06</u> 52.13	<u>4.25</u> 4.10	<u>3.80</u> 3.80	133–134	0.95 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.75–1.95 (2H, 2м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.40 (1H, с, OH); 4.68 (1H, м, CHOH); 6.88 (1H, д, J = 8.3); 7.12 (1H, д, J = 8.3, J = 2.0); 7.37 (1H, т, J = 8.0); 7.48 (1H, д, J = 8.0, J = 1.9); 7.68 (1H, д, J = 8.0, J = 1.9); 7.85 (1H, д, J = 2.0); 8.62 (1H, с, ArH); 10.35 (1H, с, NHCO)	79
45	C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> Cl <sub>2</sub> NO <sub>2</sub>	<u>59.25</u> 59.28	<u>4.57</u> 4.66	<u>4.10</u> 4.32	110–111	0.80 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.85 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.40 (1H, с, OH); 4.68 (1H, м, CHOH); 7.06 (1H, д, J = 7.7); 7.22–7.45 (4H, м); 7.57 (1H, д, J = 8.6, J = 2.6); 8.40 (1H, д, J = 8.6, ArH); 9.60 (1H, с, NHCO)	80
46	C <sub>17</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>2</sub> S	<u>67.10</u> 67.29	<u>7.15</u> 6.98	<u>4.54</u> 4.62	140–141	1.33 (9H, с, <i>t</i> -Bu); 1.64 (3H, д, J = 6.9, CH <sub>3</sub> CHOH); 3.15 (1H, с, OH); 5.05 (1H, к, J = 6.9, CHOH); 7.05 (3H, м); 7.50 (1H, д, J = 4.5); 7.59 (1H, д, J = 3.2); 8.42 (1H, д, J = 1.9, тиенил, ArH); 10.10 (1H, с, NHCO)	95
47	C <sub>22</sub> H <sub>19</sub> BrClNO <sub>4</sub>	<u>55.12</u> 55.42	<u>3.81</u> 4.02	<u>2.69</u> 2.94	176–177	3.72 (6H, 2с, CH <sub>3</sub> O); 6.06 (1H, с, CHOH); 6.22 (1H, с, OH); 7.02 (1H, с); 7.08 (1H, с); 7.20–7.34 (4H, м); 7.46 (1H, т, J = 7.8); 7.76 (1H, д, J = 7.8); 7.82 (1H, д, J = 7.9); 7.95 (1H, с, ArH); 9.98 (1H, с, NHCO)	54
48	C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> FNO <sub>4</sub>	<u>64.91</u> 65.25	<u>5.24</u> 5.48	<u>4.11</u> 4.23	132–133	0.81 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.62 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.55 (1H, м, CHOH); 5.60 (1H, с, OH); 6.80 (1H, с); 7.30–7.40 (3H, м); 7.59 (1H, м); 7.78 (1H, т, J = 7.5, ArH); 10.12 (1H, с, NHCO)	59
49	C <sub>19</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>4</sub>	<u>69.32</u> 69.71	<u>6.34</u> 6.47	<u>4.11</u> 4.28	162–163	0.80 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.65 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 2.38 (3H, с, ArCH <sub>3</sub> ); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.59 (1H, м, CHOH); 5.83 (1H, с, OH); 6.78 (1H, с); 7.32 (2H, д, J = 7.7); 7.48 (1H, с); 7.80 (2H, д, J = 7.7, ArH); 10.23 (1H, с, NHCO)	66
50	C <sub>16</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>4</sub> S	<u>60.18</u>	<u>5.43</u>	<u>4.58</u>	140–142	0.80 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.12 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 4.23 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O);	68

		60.17	5.37	4.39		4.60 (1H, м, <u>CHOH</u> ); 5.75 (1H, с, OH); 6.79 (1H, с); 7.20 (1H, д, д, $J = 4.2$ , $J = 3.9$ ); 7.34 (1H, с); 7.71 (1H, д, $J = 3.9$ ); 7.83 (1H, д, $J = 4.2$ , тиенил, ArH); 10.23 (1H, с, NHCO)	
<b>51</b>	$C_{16}H_{17}NO_5$	<u>63.10</u> 63.36	<u>5.42</u> 5.65	<u>4.21</u> 4.62	135–136	0.80 (3H, м, <u>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub></u> ); 1.62 (2H, м, <u>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub></u> ); 4.23 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 4.52 (1H, м, <u>CHOH</u> ); 5.96 (1H, с, OH); 6.69 (1H, д, д, $J = 3.2$ , $J = 1.7$ ); 6.76 (1H, с); 7.19 (1H, д, $J = 1.7$ ); 7.51 (1H, с); 7.92 (1H, д, $J = 3.2$ , фурил, ArH); 10.37 (1H, с, NHCO)	72
<b>52</b>	$C_{20}H_{17}NO_5$	<u>66.40</u> 68.37	<u>4.76</u> 4.88	<u>3.81</u> 3.99	120–121	3.55 (1H, с, OH); 4.19 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 5.85 (1H, м, <u>CHOH</u> ); 6.46 (1H, д, д, $J = 3.5$ , $J = 2.0$ ); 6.57 (1H, с); 7.06 (1H, д, $J = 2.0$ ); 7.19–7.36 (5H, м); 7.43 (1H, д, $J = 3.5$ ); 7.67 (1H, с, фурил, ArH); 9.30 (1H, с, NHCO)	63
<b>53</b>	$C_{22}H_{18}INO_4$	<u>53.94</u> 54.23	<u>3.55</u> 3.72	<u>2.64</u> 2.87	147–148	3.49 (1H, с, OH); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 5.85 (1H, с, <u>CHOH</u> ); 6.62 (1H, с); 7.08 (1H, т, $J = 8.0$ ); 7.25–7.35 (5H, м); 7.56 (1H, д, $J = 8.0$ ); 7.75–7.80 (2H, м); 7.94 (1H, с, ArH); 9.13 (1H, с, NHCO)	69
<b>54</b>	$C_{23}H_{20}ClNO_5$	<u>64.61</u> 64.87	<u>4.52</u> 4.73	<u>3.01</u> 3.29	147–148	3.82 (3H, с, CH <sub>3</sub> O); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 5.35 (1H, с, OH); 6.15 (1H, с, <u>CHOH</u> ); 6.52 (1H, с); 7.14 (1H, м); 7.23–7.47 (8H, м, ArH); 9.95 (1H, с, NHCO)	73
<b>55</b>	$C_{22}H_{17}ClINO_4$	<u>50.34</u> 50.65	<u>3.11</u> 3.28	<u>2.42</u> 2.68	176–177	3.64 (1H, с, OH); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.14 (1H, с, <u>CHOH</u> ); 6.46 (1H, с); 7.17 (1H, т, $J = 8.0$ ); 7.23–7.38 (3H, м); 7.48–7.55 (2H, м); 7.76 (1H, д, $J = 7.8$ ); 7.84 (1H, д, $J = 7.8$ ); 8.16 (1H, с, ArH); 9.05 (1H, с, NHCO)	65
<b>56</b>	$C_{20}H_{16}BrNO_4S$	<u>53.52</u> 53.82	<u>3.31</u> 3.61	<u>2.81</u> 3.14	146–147	4.24 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 5.82 (1H, с, <u>CHOH</u> ); 6.41 (1H, с, OH); 6.82 (1H, с); 7.16–7.30 (4H, м); 7.44 (2H, д, $J = 7.3$ ); 7.67 (1H, д, $J = 4.3$ ); 7.81 (1H, д, $J = 4.8$ , тиенил, ArH); 9.90 (1H, с, NHCO)	74
<b>57</b>	$C_{22}H_{17}Br_2NO_4$	<u>50.88</u> 50.89	<u>3.21</u> 3.30	<u>2.90</u> 2.70	160–161	4.24 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 5.91 (1H, с, <u>CHOH</u> ); 6.00 (1H, с, OH); 6.79 (1H, с); 7.18 (1H, с); 7.20–7.50 (7H, м); 7.69 (1H, д, $J = 8.1$ , ArH); 9.68 (1H, с, NHCO)	59

\* Соединения **43–54**, **56**, **57** – из этанола, соединение **55** – из 2-пропанола.

\*\* Спектры снимали в CDCl<sub>3</sub> (соединения **43–46**, **52**, **53**, **55**) и DMSO-d<sub>6</sub> (соединения **47–51**, **54**, **56**, **57**).

## Характеристики 4Н-3,1-бензоксазинов 58–72

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С (из этанола)*	Спектр ЯМР <sup>1</sup> Н (CDCl <sub>3</sub> ), δ, м. д. (J, Гц)	Выход, %
		С	Н	Н			
1	2	3	4	5	6	7	8
<b>58</b>	C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> BrNO	<u>60.49</u> 60.78	<u>4.32</u> 4.46	<u>4.27</u> 4.43	–	1.08 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 2.07 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 5.49 (1H, м, Н-4 бензоксазина); 7.03 (1H, т, J = 7.3); 7.19–7.41 (5H, м); 7.60–7.73 (2H, м, ArH)	91
<b>59**</b>	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> BrClNO	54.81	3.74	3.99	–	1.06 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.95 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 5.29 (1H, м, Н-4 бензоксазина); 6.86 (1H, д, J = 9.0); 7.32 (1H, д, д, J = 9.0, J = 1.8); 7.36 (1H, т, J = 8.9); 7.42–7.49 (2H, м); 8.01 (1H, д, J = 9.0, J = 1.6); 8.11 (1H, с, ArH)	65
<b>60**</b>	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> Cl <sub>2</sub> NO	62.76	4.28	4.57	–	1.10 (3H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 2.11 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 5.45 (1H, м, Н-4 бензоксазина); 7.03 (1H, д, J = 1.4); 7.23 (1H, д, J = 7.9); 7.26–7.42 (3H, м); 7.47 (1H, д, J = 7.9); 7.76 (1H, д, д, J = 7.3, J = 1.4, ArH)	53
<b>61**</b>	C <sub>17</sub> H <sub>19</sub> NOS	71.54	6.71	4.91	–	1.35 (9H, с, <i>t</i> -Bu); 1.66 (3H, д, J = 6.8, CH <sub>3</sub> ); 5.53 (1H, к, J = 6.8, Н-4 бензоксазина); 6.97 (1H, д, J = 8.8); 7.10 (1H, д, д, J = 5.4, J = 4.9); 7.21 (1H, д, д, J = 8.8, J = 2.2); 7.32 (1H, д, J = 2.2); 7.47 (1H, д, J = 5.4); 7.74 (1H, д, J = 4.9, тиенил, ArH)	71



62	$C_{22}H_{17}BrClNO_3$	<u>57.33</u> 56.78	<u>3.61</u> 3.83	<u>3.33</u> 5.91	115–116	3.78 (3H, c, $CH_3O$ ); 3.95 (3H, c, $CH_3O$ ); 6.40 (1H, c, H-4 бензоксазина); 6.90 (1H, c); 6.96 (1H, c); 7.09 (1H, д, $J = 8.0$ ); 7.15–7.29 (3H, м); 7.46 (1H, д, $J = 7.9$ ); 7.56 (1H, д, $J = 7.9$ ); 7.97 (1H, д, $J = 7.7$ ); 8.24 (1H, c, ArH)	52
63**	$C_{18}H_{16}FNO_3$	69.00	5.15	4.47	–	1.10 (3H, м, $CH_2CH_3$ ); 1.96 (2H, м, $CH_2CH_3$ ); 4.28 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 5.32 (1H, м, H-4 бензоксазина); 6.55 (1H, c); 6.84 (1H, c); 7.15–7.30 (2H, м); 7.42 (1H, д, д, $J = 8.4, J = 1.4$ ); 7.96 (1H, д, д, $J = 8.4, J = 1.6$ , ArH)	74
64	$C_{19}H_{19}NO_3$	<u>73.51</u> 73.77	<u>5.96</u> 6.19	<u>4.21</u> 4.53	81–82	1.09 (3H, м, $CH_2CH_3$ ); 1.90 (2H, м, $CH_2CH_3$ ); 2.42 (3H, c, Ar $CH_3$ ); 4.24 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 5.26 (1H, м, H-4 бензоксазина); 6.54 (1H, c); 6.86 (1H, c); 7.23 (2H, д, $J = 7.7$ ); 8.04 (2H, д, $J = 7.7$ , ArH)	83
65	$C_{16}H_{15}NO_3S$	<u>63.41</u> 63.77	<u>4.73</u> 5.02	<u>4.31</u> 4.65	–	1.05 (3H, м, $CH_2CH_3$ ); 1.90 (2H, м, $CH_2CH_3$ ); 4.25 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 5.20 (1H, м, H-4 бензоксазина); 6.50 (1H, c); 6.80 (1H, c); 7.10 (1H, д, д, $J = 5.3, J = 4.0$ ); 7.45 (1H, д, $J = 5.3$ ); 7.70 (1H, д, $J = 4.0$ , тиенил, ArH)	72
66	$C_{16}H_{15}NO_4$	<u>67.04</u> 67.36	<u>5.16</u> 5.30	<u>4.67</u> 4.91	–	1.00 (3H, м, $CH_2CH_3$ ); 1.84 (2H, м, $CH_2CH_3$ ); 4.25 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 5.17 (1H, м, H-4 бензоксазина); 6.47 (2H, м); 6.86 (1H, c); 6.98 (1H, д, $J = 3.5$ ); 7.54 (1H, д, $J = 1.8$ , фурил, ArH)	56
67	$C_{20}H_{15}NO_4$	<u>72.36</u> 72.06	<u>4.40</u> 4.54	<u>3.71</u> 4.20	174–175	4.20 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 6.25 (1H, c, H-4 бензоксазина); 6.29 (1H, c); 6.45 (1H, м); 6.96 (2H, м); 7.33–7.38 (5H, м); 7.54 (1H, д, $J = 1.8$ , фурил, ArH)	72
68	$C_{22}H_{16}INO_3$	<u>56.03</u> 56.31	<u>3.17</u> 3.44	<u>2.42</u> 2.98	154–155	4.24 (4H, м, $OCH_2CH_2O$ ); 6.31 (2H, м, H-4 бензоксазина, ArH); 6.91 (1H, c); 7.11 (1H, т, $J = 7.5$ ); 7.37 (5H, м); 7.76 (1H, д, $J = 7.6$ ); 8.03 (1H, д, $J = 7.6$ ); 8.42 (1H, c, ArH)	80

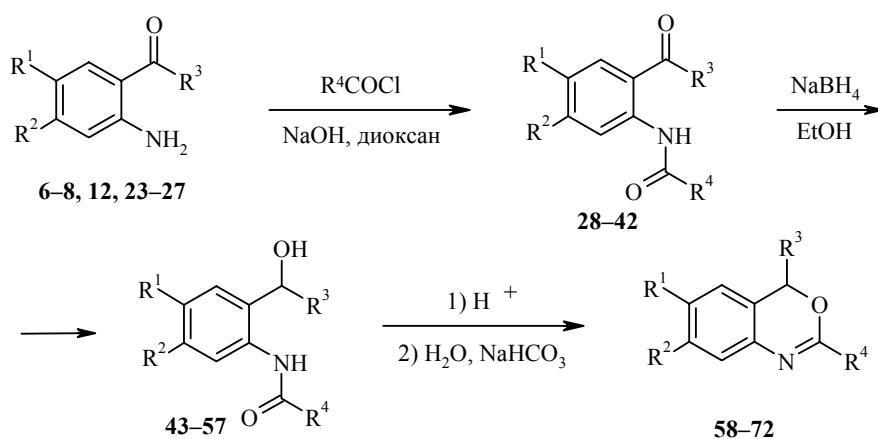
1	2	3	4	5	6	7	8
69	C <sub>23</sub> H <sub>18</sub> ClNO <sub>4</sub>	<u>67.41</u> 67.73	<u>4.17</u> 4.45	<u>3.33</u> 3.43	182–183	3.84 (3H, с, CH <sub>3</sub> O); 4.22 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.36 (1H, с, Н-4 бензоксазина); 6.78 (1H, с); 6.92–6.99 (2H, м); 7.18–7.28 (4H, м); 7.43 (1H, д, д, <i>J</i> = 8.0, <i>J</i> = 1.2); 7.58–7.65 (2H, м, ArH)	81
70	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> ClINO <sub>3</sub>	<u>52.60</u> 52.46	<u>3.17</u> 3.00	<u>2.56</u> 2.78	200–201	4.26 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.37 (1H, с, Н-4 бензоксазина); 6.83 (1H, с); 6.95 (1H, с); 7.13 (1H, т, <i>J</i> = 8.4); 7.24 (1H, д, <i>J</i> = 7.7); 7.29–7.39 (2H, м); 7.48 (1H, д, <i>J</i> = 8.2); 7.78 (1H, д, <i>J</i> = 8.4); 8.04 (1H, д, <i>J</i> = 8.4); 8.44 (1H, с, ArH)	74
71	C <sub>20</sub> H <sub>14</sub> BrNO <sub>3</sub> S	<u>56.22</u> 56.09	<u>3.41</u> 3.29	<u>2.91</u> 3.27	–	4.25 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.23 (1H, с, Н-4 бензоксазина); 6.31 (1H, с); 6.88 (1H, с); 7.04 (1H, д, д, <i>J</i> = 5.5, <i>J</i> = 4.0); 7.23 (2H, д, <i>J</i> = 8.6); 7.43 (1H, д, <i>J</i> = 5.5); 7.49 (2H, д, <i>J</i> = 8.6); 7.63 (1H, д, <i>J</i> = 4.0, тиенил, ArH)	70
72	C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> Br <sub>2</sub> NO <sub>3</sub>	<u>52.34</u> 52.72	<u>2.83</u> 3.02	<u>2.61</u> 2.79	63–64	4.25 (4H, м, OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O); 6.26 (1H, с, Н-4 бензоксазина); 6.63 (1H, с); 7.06–7.12 (3H, м); 7.22–7.32 (3H, м); 7.39 (2H, д, <i>J</i> = 8.0); 7.58 (1H, д, <i>J</i> = 7.7, ArH)	73

\* Соединения **58–61, 63, 65, 66, 71** – вязкое масло.

\*\* Элементный анализ для соединений **59–61, 63** не выполнялся. Масс-спектр, *m/z* (*I*<sub>отн.</sub>, %): соединение **59** – 351 [M]<sup>+</sup> (21.9); 322 (100); 210 (4.7); 160 (8.1); 139 (16.1); 111 (18.6); 75 (20.5); 50 (3.8); соединение **60** – 305 [M]<sup>+</sup> (20.9); 276 (100); 186 (5.2); 166 (4.4); 139 (19.4); 111 (19.1); 102 (3.7); 75 (18.1); 51 (4.1); 29 (32); соединение **61** – 285 [M]<sup>+</sup> (48.2); 270 (100); 255 (6.3); 242 (6.4); 199 (10.8); 174 (4.4); 158 (5.2); 144 (8.2); 118 (31.3); 111 (74.6); 91 (15.4); 77 (10.1); 57 (21.6); 39 (44.4); соединение **63** – 313 [M]<sup>+</sup> (16.3); 190 (100); 175 (14.0); 134 (28.8); 123 (72.5); 95 (28.8); 91 (7.5); 75 (22.5); 65 (5.2); 39 (4.3); 28 (5.2).

При этом, как было показано в настоящей работе и работах [12, 13], при нитровании указанных ацилбензолов в принятых условиях природа заместителя R<sup>3</sup> в ацильном фрагменте практически не влияет на ориентацию вступающей нитрогруппы и на выходы целевых нитросоединений, хотя в некоторых случаях, нитрование ацилбензолов приведенного типа, наряду с обычным замещением в бензольном кольце, может сопровождаться нитродеацилированием (*ipso*-замещением ацильного фрагмента) [14].

Далее удалось установить, что последовательными реакциями ацилирования синтезированных 2-аминоацилбензолов по аминогруппе, восстановлением ацильного фрагмента, непосредственно связанного с ароматическим ядром, и кислотнo-катализируемой циклизацией соответствующих амидоспиртов могут быть получены различным образом замещенные 4H-3,1-бензоксазины.



28, 29, 31, 43, 44, 46, 58, 59, 61 R<sup>1</sup> = H; 30, 45, 60 R<sup>1</sup> = Cl; 32, 47, 62 R<sup>1</sup> = R<sup>2</sup> = OMe;  
 33-42, 48-57, 63-72 R<sup>1</sup>+R<sup>2</sup> = OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O; 28, 30, 43, 45, 58, 60 R<sup>2</sup> = H; 29, 44, 59 R<sup>2</sup> = Br;  
 31, 46, 61 R<sup>2</sup> = *t*-Bu; 28-30, 33-36, 43-45, 48-51, 58-60, 63-66 R<sup>3</sup> = Et; 31, 46, 61 R<sup>3</sup> = Me;  
 32, 39, 40, 47, 54, 55, 62, 69, 70 R<sup>3</sup> = *o*-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 37, 38, 52, 53, 67, 68 R<sup>3</sup> = Ph;  
 41, 42, 56, 57, 71, 72 R<sup>3</sup> = *p*-BrC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 28, 42, 43, 57, 58, 72 R<sup>4</sup> = *o*-BrC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>;  
 29, 44, 59 R<sup>4</sup> = *m*-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 30, 45, 60 R<sup>4</sup> = *o*-ClC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>;  
 31, 35, 41, 46, 50, 56, 61, 65, 71 R<sup>4</sup> = 2-тиенил; 32, 47, 62 R<sup>4</sup> = *m*-BrC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>;  
 33, 48, 63 R<sup>4</sup> = *o*-FC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 34, 49, 64 R<sup>4</sup> = *p*-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 36, 37, 51, 52, 66, 67 R<sup>4</sup> = 2-фурил;  
 38, 40, 53, 55, 68, 70 R<sup>4</sup> = *m*-IC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; 39, 54, 69 R<sup>4</sup> = *m*-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>

Ацилирование aminoacylbenzenes **6-8, 12, 23-27** хлорангидридами карбоновых кислот протекало с высокими выходами и практически не зависело от природы заместителей как в исходных аминах, так и в кислотных фрагментах (табл. 1). В отличие от этого, природа заместителей в ацильной части соединений **28-42** влияла на скорость их восстановления боргидридом натрия. При этом для полного восстановления некоторых амидобензофенонов (например, в случае соединений **32, 39, 40**) требовалось и более длительное время реакции, и более высокое молярное соотношение реагентов. Но во всех случаях карбонильная группа амидного фрагмента не затрагивалась.

Внутримолекулярную кислотно-катализируемую циклизацию ациламинокарбинолов **47–49**, **53–55**, **57** в соответствующие 4Н-3,1-бензоксазины осуществляли под действием концентрированной серной и трифторуксусной кислот. Было установлено, что под действием конц.  $H_2SO_4$  высокие выходы 3,1-бензоксазинов достигаются только при циклизации ациламинокарбинолов, которые не содержат ацидофобных заместителей (типа фуранового и тиофенового фрагмента); циклизация фуран- и тиофеносодержащих субстратов под действием конц.  $H_2SO_4$  значительно осложнялась.\*

Оказалось далее, что ациламинокарбинолы **43–46**, **50–52**, **56** (табл. 2) способны гладко превращаться в соответствующие 4Н-3,1-бензоксазины под действием трифторуксусной кислоты более слабой, чем серная. При этом для полного завершения реакции требуется лишь несколько более длительное время и небольшое нагревание (см. экспериментальную часть). Несомненным достоинством трифторуксусной кислоты как циклизующего агента является то, что под действием этой кислоты ациламинокарбинолы с ацидофобными заместителями образуют соответствующие 4Н-3,1-бензоксазины с высокими выходами (табл. 3).

Состав и строение всех впервые полученных ациламинокетонов **28–42**, ациламинокарбинолов **43–57** и 4Н-3,1-бензоксазинов **58–72** подтверждено физико-химическими методами и данными элементного анализа (табл. 1–3). Таким образом, *о*-аминоацилбензолы можно с успехом использовать в синтезе различным образом замещенных 4Н-3,1-бензоксазинов.

## ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР  $^1H$  получали на спектрометрах Varian VXR-400 (400 МГц) в  $CDCl_3$ , внутренний стандарт  $CDCl_3$ , и Bruker AM-300 (300 МГц) в  $DMCO-d_6$ , внутренний стандарт ТМС. Масс-спектры регистрировали на приборе Finnigan SSQ-7000, тип GC-MS с использованием капиллярной колонки (30 м, неподвижная фаза DB-1, газ-носитель – гелий) и программированием температуры от 50 до 300 °С (10 град/мин). Контроль за чистотой полученных соединений осуществляли методом ТСХ на пластинках с  $Al_2O_3$  II ст. акт. в системе эфир–хлороформ–гексан, 1:1:3.

**2-Аминопропиофенон (6)** получают как описано в работе [8] с выходом 96%, т. пл. 45–46 °С (из этанола); **2-амино-4-бромпропиофенон (7)** – как в [9], выход 72%, т. пл. 85–87 °С (из этанола); **2-амино-5-хлорпропиофенон (8)** – как в [10], выход 92%, т. пл. 80 °С (из этанола).

**2-Амино-4-трет-бутилацетофенон (12)** получают восстановлением нитрозопроизводного **11** по методике [8]. Выход 74%, т. пл. 96–97 °С (из этанола). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 1.30 (9H, с, *t*-Bu); 2.55 (3H, с, Ac); 6.26 (2H, уш. с,  $NH_2$ ); 6.65 (1H, д,  $J = 2.0$ , H-3); 6.73 (1H, д, д,  $J = 9.7$ ,  $J = 2.0$ , H-5); 7.65 (1H, д,  $J = 9.7$ , H-6). Найдено, %: С 75.16; Н 8.78; N 7.16.  $C_{12}H_{17}NO$ . Вычислено, %: С 75.35; Н 8.96; N 7.32.

**2-Аминоацилбензолы 23–27** получают восстановлением нитросоединений **18–22** как описано в работе [12].

\* Подобные осложнения при циклизации тиенил- и фурилсодержащих субстратов в 4Н-3,1-бензоксазины под действием сильной протонной кислоты (хлорной) наблюдали и авторы работы [5].

**2-Амино-4,5-диметокси-2'-хлорбензофенон (23).** Выход 54%, т. пл. 51–52 °С (из смеси этанол–хлороформ, 2:1). Спектр ЯМР <sup>1</sup>Н (CDCl<sub>3</sub>), δ, м. д.: 3.60 (1Н, с, CH<sub>3</sub>O); 3.88 (1Н, с, CH<sub>3</sub>O); 6.19 (1Н, с, ArH); 6.54 (2Н, уш. с, NH<sub>2</sub>); 6.58 (1Н, с); 7.32–7.44 (4Н, м, ArH). Найдено, %: С 61.42; Н 4.71; N 4.51. C<sub>15</sub>H<sub>14</sub>ClNO<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 61.76; Н 4.84; N 4.80.

**2-Амино-4,5-этилендиоксипропиофенон (24).** Выход 73%, т. пл. 92 °С (из этанола) [12]; **2-амино-4,5-этилендиоксибензофенон (25),** выход 69%, т. пл. 135 °С (из этанола) [12]; **2-амино-4,5-этилендиокси-2'-хлорбензофенон (26),** выход 58%, т. пл. 161 °С (из этанола) [12].

**2-Амино-4,5-этилендиокси-4'-бромбензофенон (27).** Выход 71%, т. пл. 151–152 °С (из смеси этанол–хлороформ, 2:1). Спектр ЯМР <sup>1</sup>Н (DMCO-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 4.18 (2Н, м, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O); 4.30 (2Н, м, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O); 5.95 (2Н, с, NH<sub>2</sub>); 6.22 (1Н, с); 6.93 (1Н, с); 7.50–7.52 (4Н, м, ArH). Найдено, %: С 52.90; Н 3.49; N 4.19. C<sub>15</sub>H<sub>12</sub>BrNO<sub>3</sub>. Вычислено, %: С 53.91; Н 3.62; N 4.19.

**о-Ациланилиды 28–42** (общая методика). К раствору 0.01 моль соответствующего о-аминоацилбензола (**6–8, 12, 23–27**) в 30 мл диоксана при перемешивании постепенно добавляют одновременно 0.01 моль хлорангидрида соответствующей кислоты и 0.01 моль 3 н. раствора NaOH, перемешивают 30 мин и выливают в 300 мл воды. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают водой и перекристаллизовывают из подходящего растворителя.

**о-Ациламинобензиловые спирты 43–57** (общая методика). К раствору 10 ммоль NaBH<sub>4</sub> в 20 мл этанола в течение 30 мин при перемешивании прибавляют 20 ммоль (для соединений **28–31** – 10 ммоль) соответствующего амидоацилбензола **28–42**. Реакционную смесь нагревают до 40–50 °С, перемешивают 30 мин – 2 ч до завершения реакции (контроль методом ТСХ) и медленно добавляют к ней 10% раствор HCl до слабокислой реакции. Водно-спиртовой раствор выливают в 150 мл воды. Выпавший продукт восстановления отфильтровывают и перекристаллизовывают из подходящего растворителя.

**Циклизация о-ациламинобензиловых спиртов 47–49, 53–55, 57 в 4Н-3,1-бензоксазины 62–64, 68–70, 72 под действием серной кислоты** (общая методика). А. К 10-кратному (к массе исходного карбинола) количеству конц. H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> (*d* 1.84), охлажденной от 0 до –5 °С добавляют 1 ммоль амидоспирта **47–49, 53–55, 57** и перемешивают смесь до образования однородного раствора (от 30 мин до 1 ч). Сернокислый раствор продукта циклизации выливают в смесь 20 мл воды и 20 г льда, реакционную смесь нейтрализуют NaHCO<sub>3</sub>, экстрагируют хлороформом, экстракт промывают водой и сушат MgSO<sub>4</sub>. После упаривания растворителя целевое соединение выделяют хроматографированием в толстом слое оксида алюминия.

**Циклизация о-ациламинобензиловых спиртов 43–46, 50–52, 56 в 4Н-3,1-бензоксазины 58–61, 65–67, 71 под действием трифторуксусной кислоты** (общая методика). Б. К 10-кратному (к массе исходного спирта) количеству CF<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>H (*d* 1.48) порциями при перемешивании добавляют 1 ммоль амидоспирта **43–46, 50–52, 56**, нагревают до 40 °С и выдерживают при этой температуре 1 ч. После охлаждения до комнатной температуры реакционную массу выливают в смесь 20 мл воды и 20 г льда и нейтрализуют NaHCO<sub>3</sub>, экстрагируют хлороформом, промывают водой и сушат MgSO<sub>4</sub>, растворитель упаривают, остаток хроматографируют в толстом слое оксида алюминия.

*Работа выполнена при финансовой поддержке гранта "Ведущая научная школа академика Н. С. Зефирова".*

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Н. Kuch, K. Schmitt, G. Seidl, J. Hoffman, BRD Pat. 1670772 (1978); *РЖХим.*, 30158 (1979).
2. S. Gabriel, T. Posner, *Ber.*, **27**, 3509 (1894).
3. O. Widmann, *Ber.*, **16**, 2576 (1883).
4. A. G. Bayer, Заявка ФРГ № 3806490 (1989); *РЖХим.*, 100403П (1990).

5. Е. В. Громачевская, Т. П. Косулина, А. Л. Чехун, В. Г. Кульневич, *ХГС*, 542 (1993). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **29**, 465 (1993)].
6. Е. В. Громачевская, В. Г. Кульневич, Д. П. Ельчинов, Т. П. Косулина, А. Л. Чехун, *ХГС*, 547 (1993). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **29**, 469 (1993)].
7. С. С. Мочалов, Р. А. Газзаева, А. Н. Федотов, Ю. С. Шабаров, Н. С. Зефилов, *ХГС*, 922 (2003). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **39**, 794 (2003)].
8. А. Н. Федотов, С. С. Мочалов, Ю. С. Шабаров, *Журн. прикл. химии*, **50**, 1860 (1977).
9. Ю. С. Шабаров, С. С. Мочалов, *ЖОрХ*, **8**, 293 (1972).
10. Ю. С. Шабаров, С. С. Мочалов, *ХГС*, 1334 (1973). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **9**, 1207 (1973)].
11. Р. А. Газзаева, А. Н. Федотов, Е. В. Трофимова, О. А. Попова, С. С. Мочалов, Н. С. Зефилов, *ЖОрХ*, **42**, 94 (2006).
12. С. С. Мочалов, Д. В. Косынкин, И. Д. Юдин, В. И. Атанов, Ю. С. Шабаров, Н. С. Зефилов, *ХГС*, 601 (1994). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **30**, 527 (1994)].
13. В. К. Даукшас, Э. Б. Удренайте, *ХГС*, 1155 (1975). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **11**, 1003 (1975)].
14. В. К. Даукшас, Э. Б. Удренайте, *Науч. тр. вузов ЛитССР, Химия и хим. технол.*, **16**, 191 (1974).

<sup>a</sup>Северо-Осетинский государственный  
университет им. К. Л. Хетагурова,  
Владикавказ 362025, Россия

Поступило 14.03.2006

Московский государственный университет  
им. М. В. Ломоносова, Москва 119899, Россия  
e-mail: ssmoch@org.chem.msu.ru