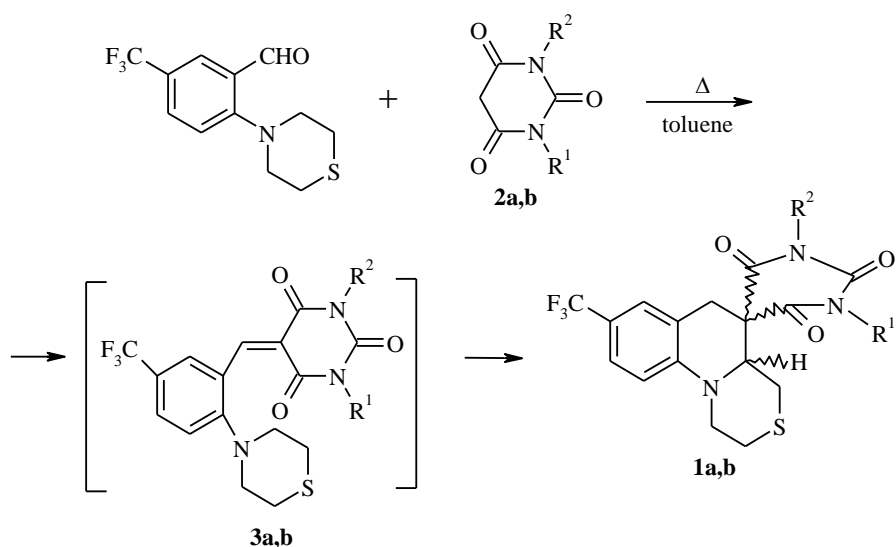


**ОДНОСТАДИЙНЫЙ СИНТЕЗ  
НОВОЙ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКОЙ СИСТЕМЫ –  
СПИРО[[1,4]ТИАЗИНО[4,3-*a*]ХИНОЛИН-5,5'-ПИРИМИДИНА]**

**Ключевые слова:** спиросоединения, [1,4]тиазино[4,3-*a*]хинолин, конденсация Кневенагеля, *трет*-аминоэффект.

Мы обнаружили, что при взаимодействии в условиях конденсации Кневенагеля 2-тиоморфолино-5-трифторметилбензальдегида с барбитуровыми кислотами образуется новая гетероциклическая система – 1,2,4,4*a*,5,6-гексагидроспиро[[1,4]тиазино[4,3-*a*]хинолин-5,5'-пиримидин]-2',4',6'-трионы **1a,b**, т. е. в ходе реакции происходит образование двух



1–3 а R<sup>1</sup> = R<sup>2</sup> = Me, б R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>CF<sub>3</sub>-4

новых связей С–С. Реакция протекает через *o*-винилпроизводные **3** [1, 2] с последующей их циклизацией по механизму *трет*-аминоэффекта [3, 4]. В случае использования монозамещенных барбитуровых кислот возможно образование двух изомеров. Мы показали, что с монозамещенной барбитуровой кислотой **2b** образуется смесь состава 1:1 спиросочлененных конденсированных [1,2-*a*]хинолинов **1b** с выходом 78%. Один из изомеров можно выделить с выходом 33% при помощи дробной кристаллизации из водного спирта.

Спектры ЯМР <sup>1</sup>H снимали на приборе Bruker 250 (250 МГц) в ДМСО-*d*<sub>6</sub>, внутренний стандарт ТМС.

**1',3'-Диметил-8-(трифторметил)-1,2,4,4*a*,5,6-гексагидроспиро[[1,4]тиазино[4,3-*a*]хинолин-5,5'-пиримидин]-2',4',6'-трион (1a).** Раствор 0.275 г (1.00 ммоль) 2-тиоморфолино-5-трифторметилбензальдегида и 0.156 г (1.00 ммоль) N,N'-диметилбарбитуровой кислоты кипятят в 10 мл толуола. Через 3 ч растворитель упаривают в вакууме досуха и остаток перекристаллизовывают из водного спирта. Выход 0.175 г (72%). Т. пл. 222 °С. Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (*J*, Гц): 7.33 (1H, с, ArH); 7.30 (1H, д, *J* = 8.5, ArH); 6.90 (1H, д, *J* = 8.5, ArH); 4.44 (1H, д, *J* = 14.7, CH); 4.13 (1H, д, *J* = 10.3, CH); 3.54 (1H, д, д, *J* = 11.9, *J* = 13.1, CH); 3.47 и 2.87 (2H, АВ, *J* = 17.7, ArCH<sub>2</sub>); 3.20 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 3.12 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.85 (1H, д, д, *J* = 13.1, *J* = 10.3, CH); 2.54 (1H, д, д, *J* = 14.7, *J* = 10.3, CH);

2.17 (1H, д,  $J = 13.4$ , CH); 2.08 (1H, д,  $J = 13.4$ , CH). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 413 [ $M^+$ ] (92). Найдено, %: N 10.28.  $C_{18}H_{18}F_3N_3O_3S$ . Вычислено, %: N 10.16.

*1'-(4-Трифторметилфенил)-8-(трифторметил)-1,2,4,4а,5,6-гексагидроспиро[[1,4]-тиазино[4,3-а]хинолин-5,5'-пиримидин]-2',4',6'-трион (1b).*  
**Кипятят 3 мин раствор 0.275 г (1.00 ммоль) 2-тиоморфолино-5-трифторметилбензальдегида и 0.272 г (1.00 ммоль) N-р-трифторметилфенилбарбитуровой кислоты в 2.0 мл ДМФА, добавляют 100 мл воды, осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из водного спирта. Выход 0.175 г (33%). Т. пл. 167–168 °С. Спектр ЯМР  $^1H$ ,  $\delta$ , м. д. (J, Гц): 11.51 (1H, с, NH); 7.77 (2H, д,  $J = 8.5$ , ArH); 7.49 (2H, д,  $J = 8.5$ , ArH); 7.36 (1H, с, ArH); 7.31 (1H, д,  $J = 8.8$ , ArH); 6.94 (1H, д,  $J = 8.8$ , ArH); 4.51 (1H, д,  $J = 14.3$ , CH); 4.41 (1H, д,  $J = 10.6$ , CH); 3.60 (1H, д,  $J = 12.5$ ,  $J = 13.1$ , CH); 3.47 и 2.97 (2H, АВ,  $J = 17.4$ , ArCH<sub>2</sub>); 2.89 (1H, д,  $J = 13.1$ ,  $J = 11.6$ , CH); 2.63 (1H, д,  $J = 11.6$ ,  $J = 10.6$ , CH); 2.24 (1H, д,  $J = 13.7$ , CH); 2.14 (1H, д,  $J = 13.7$ , CH). Масс-спектр,  $m/z$  ( $I_{\text{отн}}$ , %): 529 [ $M^+$ ] (89). Найдено, %: N 8.08.  $C_{23}H_{17}F_6N_3O_3S$ . Вычислено, %: N 7.94.**

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Е. В. Дьяченко, Т. В. Глухарева, Ю. Ю. Моржерин, ХГС, 1737 (2003).
2. N. Kaval, B. Halasz-Dajka, G. Vo-Thanh, W. Dehaen, J. Van der Eycken, P. Mátyus, A. Loupy, E. Van der Eycken, *Tetrahedron*, **61**, 9052 (2005).
3. W. Verboom, D. N. Reinhoudt, *Rec. Trav. Chim. Pay-Bas.*, **109**, 311 (1990).
4. V. Tverdokhlebov, A. P. Gorulya, A. A. Tolmachev, A. N. Kostyuk, A. N. Chernega, E. B. Rusanov, *Synthesis*, **37**, 2161 (2005).

**И. В. Парамонов, Н. А. Беляев, Т. В. Глухарева, А. С. Волков,  
Е. В. Деева, Ю. Ю. Моржерин**

Уральский государственный  
технический университет – УПИ,  
Екатеринбург 620002, Россия  
e-mail: [morzherin@htf.ustu.ru](mailto:morzherin@htf.ustu.ru)

Поступило в редакцию 24.08.2005

ХГС. – 2006. – № 1. – С. 141