

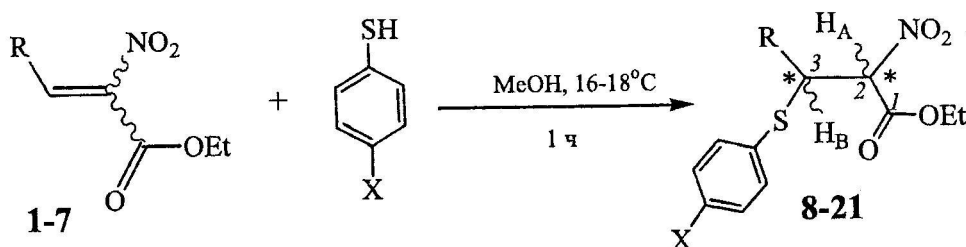
ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ α -НИТРОАКРИЛАТОВ С АРИЛТИОЛАМИ

Р.И. Байчурина, Л.В. Байчурина, Н.И. Абоскалова, В.М. Берестовицкая

Санкт-Петербург, РГПУ им. А.И. Герцена
kohrgpu@yandex.ru

Введение в молекулы акрилатов в *гем*-положение к сложноэфирной функции еще одного электроноакцепторного заместителя – нитрогруппы существенно увеличивает электрофильность кратной С=C связи и открывает широкие перспективы для синтеза замещенных аналогов природных и неприродных α -аминокислот [1, 2]. Кроме того известно, что широкий спектр практически полезных свойств органических соединений серы (лекарственные препараты, пестициды, антиоксиданты и т.д.) обуславливает повышенный интерес к методам синтеза новых серусодержащих структур. Например, фармакофорный β -аминотиольный фрагмент входит в состав антибиотиков пенициллинового ряда, комплексона тяжелых металлов пенициллина, витамина H (биотин), муколитического средства карбоцистеина, фунгицида сульфоназола, стимулятора лейкопоеза лейкогена, противовирусного препарата арбидола [3, 4]. Однако, сведения о реакциях высоко реакционноспособных α -нитроакрилатов [5, 6] с ароматическими *S*-мононуклеофилами в литературе отсутствуют. В этой связи целью настоящей работы явилось изучение взаимодействия β -арил(гетерил)- α -нитроакрилатов с представителями арилтиолов.

Оказалось, что α -нитрокоричные эфиры и их гетероаналоги (1-7) реагируют с 4-метил- и 4-хлортиофенолами в очень мягких условиях – в метаноле без катализатора при комнатной температуре и выдержке 1 ч; выходы линейных *S*-аддуктов (8-21) достигают 97%.



R = Ph (1), 4-MeOC₆H₄ (2), 4-Me₂NC₆H₄ (3), 4-ClC₆H₄ (4), 4-O₂NC₆H₄ (5), 2-фурил (6), 2-тиенил (7);
R = Ph: X = Me (8), Cl (9); R = 4-MeOC₆H₄: X = Me (10), Cl (11); R = 4-Me₂NC₆H₄: X = Me (12), Cl (13);
R = 4-ClC₆H₄: X = Me (14), Cl (15); R = 4-O₂NC₆H₄: X = Me (16), Cl (17); R = 2-фурил: X = Me (18), Cl (19);
R = 2-тиенил: X = Me (20), Cl (21)

Строение полученных 3-арилсульфанил-2-нитропропаноатов (8-21) охарактеризовано совокупностью методов ИК, ЯМР ¹H и ¹³C{¹H} спектроскопии с привлечением гетерокорреляционных НМРС и НМВС экспериментов. Судя по спектрам ЯМР ¹H, соединения (8-10, 14) представляют собой диастереомерно чистые вещества, а остальные – смеси диастереомеров.

Предложенный метод синтеза ранее не известных *S*-аддуктов (8-21) отличается простым аппаратным оформлением, высокой эффективностью и вполне пригоден для масштабирования, а полученные продукты представляют интерес, как предшественники модифицированных α -аминокислот (фенилаланина и его аналогов), содержащих в β -положении арилтиольную группу.

Список литературы

1. Перекалин В.В., Тэмп А.А. Авт. свид. СССР 209465 // Б.И. 1968. № 5. С. 33. С.А. 1968. Vol. 69. 77732x.
2. Абоскалова Н.И., Полянская А.С., Перекалин В.В. // ДАН СССР. 1967. Т. 176. № 4. С. 829.
3. Мальцев О.В., Белецкая И.П., Злотин С.Г. // Усп. Химии. 2011. Т. 80. № 11. С. 1119.
4. Машковский М.Д. Лекарственные средства (16-е изд.). М.: РИА «Новая волна». 2012. 1216 с.
5. Байчурина Л.В., Байчурина Р.И., Абоскалова Н.И., Берестовицкая В.М. // ЖОХ. 2010. Т. 80. Вып. 10. С. 1712.
6. Байчурина Л.В., Байчурина Р.И., Филиппенко М.В., Абоскалова Н.И., Берестовицкая В.М. // ЖОХ. 2012. Т. 82. Вып. 8. С. 1321.