

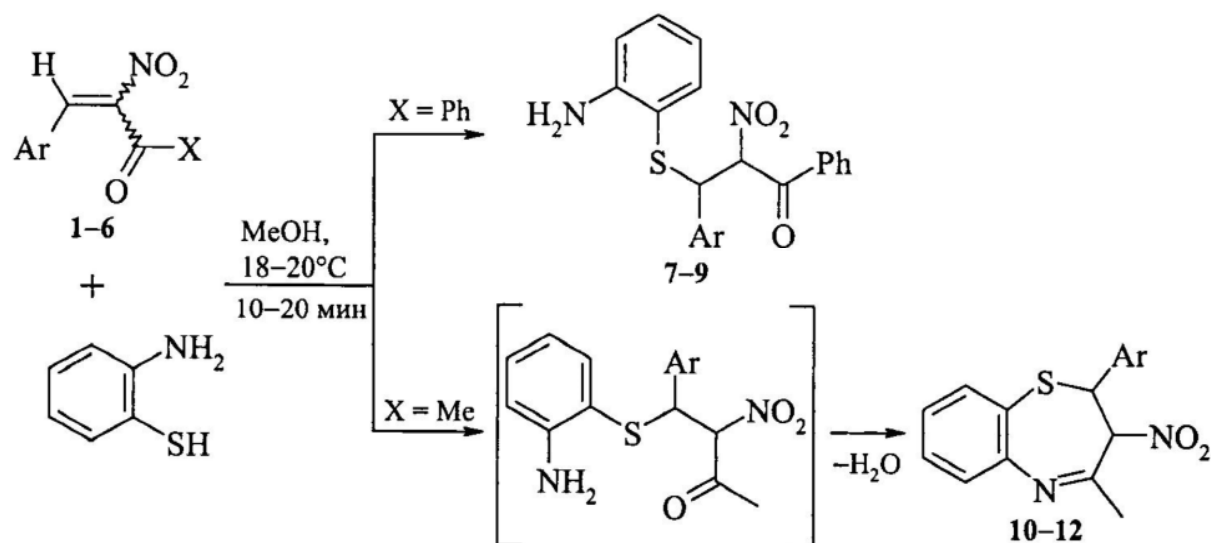
Нитросодержащие 2,3-дигидро-1,5-бензотиазепины

Берестовицкая В.М., Байчурин Р.И., Абоскалова Н.И.

Российский государственный педагогический университет им. А.И. Герцена
191186, г. Санкт-Петербург, наб. р. Мойки, д. 48
тел./факс: (812) 571-38-00; e-mail: kohrgpu@yandex.ru

Широкое применение в медицинской практике лекарственных средств, содержащих в молекулах семичленные азепиновые, диазепиновые и тиазепиновые циклы (например карбамазепин, оланзапин, дилтиазем [1]), явилось мощным стимулом для развития исследований, направленных на разработку новых методов синтеза этих гетероциклических систем, а также на расширение ассортимента их производных.

С целью получения новых функциональнозамещенных тиазепиновых структур нами изучена реакция *гем*-ацилнитроэтонов **1–6**, являющихся весьма доступными и реакционноспособными соединениями, с *o*-аминотиофенолом. Оказалось, что в отличие от *енкетонов* (кипячение в растворе метанола в присутствии Et₃N в течение 4–5 ч [2]) нитроеноны вступают в эту реакцию в очень мягких условиях (метанол, отсутствие катализатора, 18–20°C, 10–20 мин), причем образующиеся кристаллические продукты сразу выпадают из реакционных растворов.



X = Ph (**1–3**), Me (**4–6**); Ar = Ph (**1, 4, 7, 10**), *p*-MeOC₆H₄ (**2, 5, 8, 11**), *p*-Me₂NC₆H₄ (**3, 6, 9, 12**)

В результате с высокими выходами (до 100%) выделены два типа соединений – линейные *S*-аддукты **7–9** (в случае *гем*-бензоилнитростирола) или циклические 2,3-дигидро-1,5-бензотиазепиновые структуры **10–12** (в случае *гем*-ацетилнитростирола). Строение синтезированных соединений **7–12** доказано методами ИК и ЯМР (¹H, ¹³C, COSY, HMQC) спектроскопии.

1. Машковский М.Д., *Лекарственные средства*, изд. 15-е, М.: РИА "Новая волна", Издатель Уменков, 2007, с. 41, 68, 433.
2. Орлов В.Д., Колос Н.Н., Ружицкая Н.Н., *ХГС* **1983** (12) 1638.