

α -НИТРОАКРИЛАТЫ В РЕАКЦИЯХ С 4-МЕТИЛ(ХЛОР)ТИОФЕНОЛАМИ

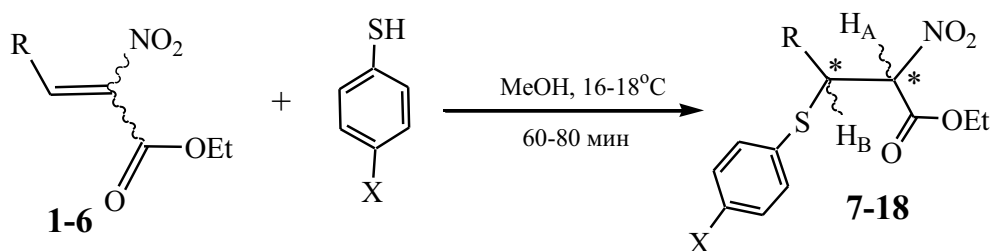
Манякина О.С., Байчурина Л.В., Байчурин Р.И.

Санкт-Петербург, РГПУ им. А.И. Герцена

kohrgpu@yandex.ru

α -Нитроакрилаты проявляют высокую активность в реакциях с *C*-, *N*- и *O*-нуклеофильными реагентами. Однако, сведения о их взаимодействии с ароматическими *S*-мононуклеофилами в литературе отсутствуют. Между тем широкий спектр практически полезных свойств органических соединений серы (лекарственные препараты, пестициды, антиоксиданты и т.д.) обуславливает повышенный интерес к методам синтеза их новых производных.

В настоящей работе исследовано взаимодействие β -арил(гетерил)- α -нитроакрилатов (**1-6**) с представителями ароматических тиолов – 4-метил- и 4-хлортиофенолами. Реакции протекают при непродолжительной выдержке (60-80 мин) эквимольной смеси реагентов в абсолютном метаноле при 16-18°C и завершаются образованием продуктов тиолирования по кратной C=C связи – этил-3-арил(гетерил)-3-арилсульфанил-2-нитропропаноатов (**7-18**) с выходами до 92%.



R = Ph (**1**), 4-MeOC₆H₄ (**2**), 4-Me₂NC₆H₄ (**3**), 4-ClC₆H₄ (**4**), 4-O₂NC₆H₄ (**5**), 2-тиенил (**6**);

R = Ph: X = Me (**7**), Cl (**8**); R = 4-MeOC₆H₄: X = Me (**9**), Cl (**10**);

R = 4-Me₂NC₆H₄: X = Me (**11**), Cl (**12**); R = 4-ClC₆H₄: X = Me (**13**), Cl (**14**);

R = 4-O₂NC₆H₄: X = Me (**15**), Cl (**16**); R = 2-тиенил: X = Me (**17**), Cl (**18**)

Синтезированные *S*-аддукты (**7-10**, **12**, **13**, **15**, **16**) представляют собой твердые кристаллические вещества с четкими температурами плавления. *S*-аддукты (**11**, **14**, **17**, **18**) выделены в виде масел.

Строение впервые полученных соединений (**7-18**) доказано методами ИК, ЯМР ¹H и ¹³C спектроскопии (с привлечением гетерокорреляционных НМРС и НМВС экспериментов), их состав подтвержден элементным анализом. Соединения (**7-9**, **13**), судя по спектрам ЯМР ¹H, удалось выделить в виде индивидуальных диастереомеров. Следует отметить, что диастереооднородное соединение (**9**) при выдержке в растворе CDCl₃ в течение суток превращается в смесь диастереомеров в соотношении 1.47:1.

Полученные *S*-аддукты (**7-18**) представляют несомненный практический интерес, так как являются предшественниками модифицированных α -аминокислот (фенилаланина и его аналогов), содержащих арилтиольную группу в β -положении. Известно, что фармакофорный β -аминотиольный фрагмент входит в структуры антибиотиков (пенициллин, пеницилламин), витамина Н (биотин), фунгицидов (сулконазол) и т.д.