

## Внутримолекулярная циклизация 2-(гетероарилсульфанил)-*N*-(3-оксоалкенил)ацетамидов: синтез 3-(гетероарилсульфанил)- и 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-онов

Ольга А. Савченко<sup>1</sup>, Вера В. Мусияк<sup>2</sup>, Дмитрий С. Гончаров<sup>1</sup>, Юлия П. Богза<sup>1</sup>,  
Антон Л. Шацаускас<sup>3</sup>, Валентин П. Талзи<sup>4</sup>, Сергей Н. Евдокимов<sup>4</sup>,  
Евгений Б. Ульяновкин<sup>3</sup>, Александр С. Фисюк<sup>3\*</sup>

<sup>1</sup> Омский государственный университет им. Ф. М. Достоевского,  
пр. Мира, 55а, Омск 644077, Россия

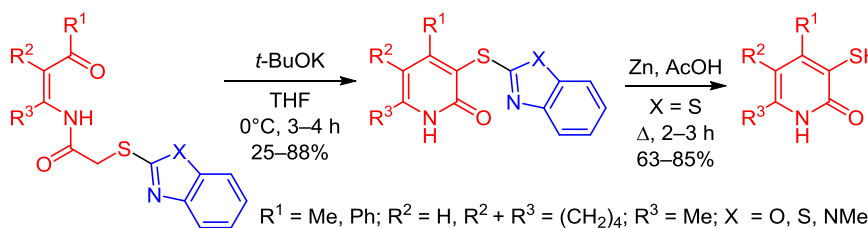
<sup>2</sup> Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,  
ул. С. Ковалевской, 22 / Академическая, 20, Екатеринбург 620108, Россия.

<sup>3</sup> Омский государственный технический университет,  
пр. Мира, 11, Омск 644050, Россия; e-mail: fisyuk@chemomsu.ru

<sup>4</sup> Центр новых химических технологий Института катализа им. Г. К. Борескова СО РАН,  
ул. Нефтезаводская, 54, Омск 644040, Россия

Поступило 15.03.2020

Принято 17.04.2020



Реакцией *N*-(3-оксоалкенил)хлорацетамидов с 1,3-бензотиазол-2(3*H*)-тионом, 1,3-бензоксазол-2(3*H*)-тионом и 1-метил-1,3-дигидро-2*H*-бензимидазол-2-тионом получены 2-(гетероарилсульфанил)-*N*-(3-оксоалкенил)ацетамиды. Эти соединения при действии основания превращены в пиридин-2(1*H*)-оны, содержащие в положении С-3 атом двухвалентной серы, связанный с гетероциклом. Изучено бромирование, нитрование, алкилирование 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)пиридин-2(1*H*)-онов. Действием цинка в уксусной кислоте на эти соединения получены 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-оны.

**Ключевые слова:** 1,3-бензоксазол-2(3*H*)-тион, 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)пиридин-2(1*H*)-он, 1,3-бензотиазол-2(3*H*)-тион, 1-метил-1,3-дигидро-2*H*-бензимидазол-2-тион, *N*-(3-оксоалкенил)хлорацетамиды, 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-оны, внутримолекулярная циклизация.

Известные методы синтеза 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-онов немногочисленны. Они основаны на превращениях тиазоло[4,5-*b*]пиридинов<sup>1</sup> или введении тиогруппы через диазониевые соли, полученные из труднодоступных 3-амино-2-метоксипиридинов.<sup>2</sup> 3-Сульфанилпиридин-2(1*H*)-оны и 3-сульфанилхинолин-2(1*H*)-оны используются для синтеза 2-пиридонов или 2-хинолонов, содержащих в положении С-3 атом двухвалентной серы, связанной с алкильной, арильной группами или гетероциклом.<sup>2–9</sup> Интерес к таким соединениям обусловлен прежде всего их биологической активностью.<sup>10–19</sup> Среди них найдены соединения, эффективные при лечении эректильной дисфункции,<sup>3–6</sup> рака,<sup>7,8</sup> обладающие противовирусной активностью,<sup>9</sup>

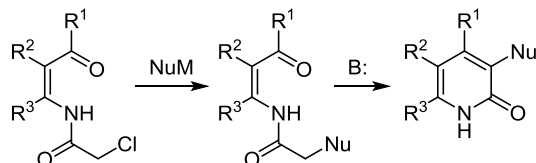
включая ВИЧ,<sup>2,20</sup> антагонисты каннабиноидных рецепторов.<sup>21</sup>

Для синтеза 3-замещенных пиридин-2(1*H*)-онов и их гидрированных производных нами была предложена стратегия,<sup>22</sup> основанная на нуклеофильном замещении галогена в *N*-(3-оксоалкенил)- или *N*-(3-оксоалкил)-хлорацетамидах на функциональную группу с последующей внутримолекулярной циклизацией полученного интермедиата. Такая стратегия позволяет на основе единственного субстрата и нескольких нуклеофилов получать пиридин-2(1*H*)-оны или их гидрированные производные с различными заместителями в положении С-3.<sup>23–29</sup> Были изучены закономерности этой циклизации<sup>30</sup> и показано, что замена амидной

группы на тиоамидную<sup>31</sup> или введение в  $\alpha$ -положение по отношению к карбоамидной группе атома двухвалентной серы приводит к повышению кислотности, достаточному для протекания внутримолекулярной циклизации.<sup>32</sup>

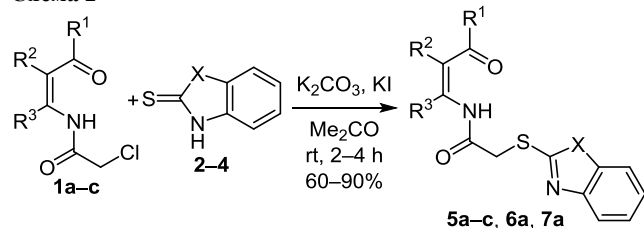
Ввести двухвалентный атом серы в молекулу можно путем *S*-алкилирования тиолов<sup>3,6,21</sup> или циклических тиокарбаматов, дитиокарбаматов и тиомочевин.<sup>27</sup> Последние соединения являются кристаллическими и не обладают неприятным запахом в отличие от тиолов. О возможности такого подхода мы сообщали ранее (схема 1).<sup>27</sup>

### Схема 1



Взаимодействием легкодоступных<sup>23</sup> *N*-(3-оксоалкенил)-хлорацетамидов **1a–c** с 1,3-бензотиазол-2(3*H*)-тионом (**2**), 1,3-бензоксазол-2(3*H*)-тионом (**3**) и 1-метил-1,3-дигидро-2*H*-бензимидазол-2-тионом (**4**) были получены соединения **5a–c**, **6a**, **7a** с выходами 60–90%. Алкилирование тионов хлорацетамидами **1a–c** проводили в безводном Me<sub>2</sub>CO при комнатной температуре в присутствии K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> и каталитических количеств KI. Ранее<sup>27</sup> для синтеза соединения **5a** в качестве растворителя использовался ДМФА. Замена ДМФА на Me<sub>2</sub>CO привела к сокращению времени реакции с нескольких суток до 4 ч, а также к увеличению выхода соединения **5a** с 78 до 90% (схема 2).

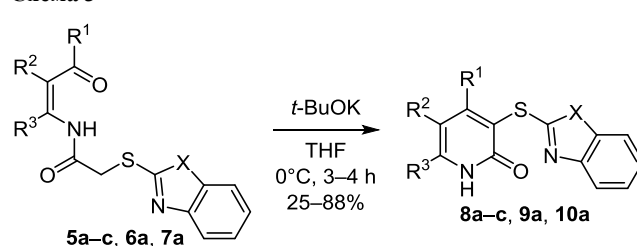
### Схема 2



**a** R<sup>1</sup> = R<sup>3</sup> = Me, R<sup>2</sup> = H; **b** R<sup>1</sup> = Ph, R<sup>2</sup> = H, R<sup>3</sup> = Me;  
**c** R<sup>1</sup> = Me, R<sup>2</sup> + R<sup>3</sup> = (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>;  
**2, 5** X = S; **3, 6** X = O; **4, 7** X = NMe

Ранее *N*-(3-оксоалкил)амиды гетероарилсульфанилуксусных кислот были использованы нами для синтеза замещенных 5,6-дигидропиридин-2(1*H*)-онов.<sup>27,33</sup> Возможность внутримолекулярной циклизации *N*-(3-алкенил)-амидов была показана лишь на единственном примере.<sup>27</sup> Соединения **5a–c**, **6a**, **7a** были введены в реакцию с *tert*-бутилатом калия в ТГФ, продуктами которой оказались пиридин-2(1*H*)-оны **8a–c**, **9a**, **10a**, содержащие в положении С-3 двухвалентный атом серы, связанный с гетероциклом. Пиридоны **8a–c** получены с выходами 60–88%, в случае соединений **9a** и **10a** реакции протекали с низкими выходами (25–27%) и сопровождалась образованием побочных продуктов (схема 3).

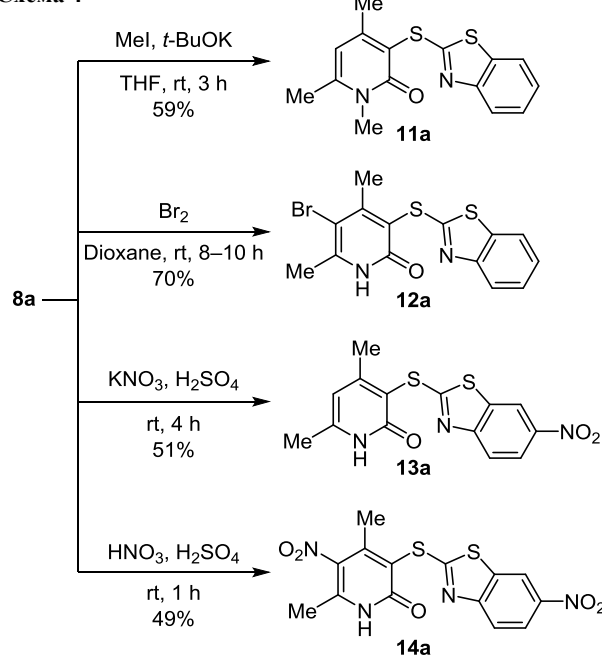
### Схема 3



**a** R<sup>1</sup> = R<sup>3</sup> = Me, R<sup>2</sup> = H; **b** R<sup>1</sup> = Ph, R<sup>2</sup> = H, R<sup>3</sup> = Me;  
**c** R<sup>1</sup> = Me, R<sup>2</sup> + R<sup>3</sup> = (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>;  
**5, 8** X = S; **6, 9** X = O; **7, 10** X = NMe

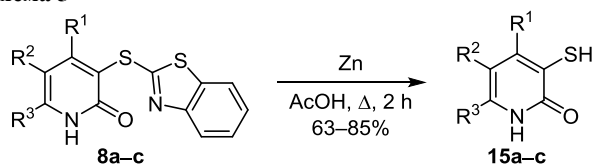
Мы изучили превращения 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)-4,6-диметилпиридин-2(1*H*)-она (**8a**) в реакциях алкилирования и электрофильного замещения. Алкилирование иодистым метилом соединения **8a** привело к *N*-метилзамещенному пиридин-2(1*H*)-ону **11a**. При действии брома на соединение **8a** в диоксане протекало электрофильное замещение с образованием 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)-5-бром-4,6-диметилпиридин-2(1*H*)-она (**12a**). Выход бромпроизводного **12a** составил 70%. В то же время нитрование 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)-4,6-диметилпиридин-2(1*H*)-она (**8a**) смесью KNO<sub>3</sub> и H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> протекало по бензотиазолу. Известно, что реакция 2-(алкилсульфанил)бензотиазолов с нитрующей смесью приводит к 2-(алкилсульфанил)-6-нитро-1,3-бензотиазолам.<sup>34,35</sup> По-видимому, в нашем случае реакция идет по тому же положению с образованием продукта **13a**, о чем свидетельствует спин-спиновое взаимодействие между протонами в бензольном цикле бензотиазольного фрагмента. При использовании нитрующей смеси (HNO<sub>3</sub>–H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, 1:4) из соединения **8a** было получено динитропроизводное **14a** с выходом 49%. В этом случае нитрованию подвергались как пиридиновый цикл, так и бензотиазол (схема 4).

### Схема 4



Ранее было показано, что 2-хинолоны, содержащие в положении С-3 атом двухвалентной серы, связанный с гетероциклом, при нагревании с морфолином превращаются в 3-меркаптозамещенные производные с выходами 31–35%.<sup>36</sup> В то же время 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)пиридин-2(1*H*)-он **8a** в аналогичных условиях в реакцию не вступает. С целью получения 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-онов **15a–c** мы изучили взаимодействие соединений **8a–c** с цинком в AcOH, приводящее к восстановлению связи С=N в бензотиазоле и последующему расщеплению гетероцикла.<sup>37</sup> Выходы 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-онов **15a–c** составили 63–85% (схема 5).

#### Схема 5



Строение всех полученных соединений подтверждено данными ИК спектров, спектроскопией ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $^{13}\text{C}$  и элементным анализом. Спектры ЯМР достаточно просты в интерпретации, однако следует учитывать особенности прототропных таутомерных превращений, характерных для пиридин-2(1*H*)-онов. Положение пиридон-пиридольного таутомерного равновесия зависит от ряда факторов: концентрации раствора, типа растворителя, температуры, строения соединения и др.<sup>38</sup> Если скорость протонного обмена достаточно высока, то наблюдается усредненный сигнал двух таутомерных форм. При уменьшении скорости сигналы уширяются, а при низкой скорости – фиксируются обе таутомерные формы.<sup>39</sup> Скорость таутомерных превращений соединений **8a–c**, **10–14 a**, **15a–c** в масштабах времени ЯМР достаточно высока, поэтому в спектрах присутствуют узкие усредненные сигналы обеих таутомерных форм. В то же время в спектре ЯМР  $^{13}\text{C}$  соединения **9a**, записанном в  $\text{DMSO-}d_6$  при комнатной температуре, часть сигналов атомов углерода проявляется в виде уширенных пиков, различимых только после длительного накопления (рис. 1). Это свидетельствует о средней скорости обмена.

Уменьшение вязкости растворителя должно приводить к увеличению скорости равновесия. Действительно, при замене  $\text{DMSO-}d_6$  на менее вязкий  $\text{CDCl}_3$ , сигналы ядер углерода в спектрах ЯМР  $^{13}\text{C}$  выглядели как узкие пики даже при пониженной температуре. Однако соединение **9a** в растворе хлороформа, в отличие от соединений **8**, **10 a**, по-видимому, существует преимущественно в виде пиридин-2-ола. В спектрах соединений **8**, **10 a** валентные колебания связи NH находятся в области  $3425\text{--}3475\text{ см}^{-1}$  в виде уширенного сигнала, в то же время сигнал группы OH соединения **9a** фиксируется при  $3273\text{ см}^{-1}$ . В спектре ЯМР  $^{13}\text{C}$  соединения **9a** сигналы атомов С-3 и С-5 отмечаются при 131.5 и 131.3 м. д., в то время как в спектрах пиридин-2(1*H*)-онов **8a** и **10a** они находятся в

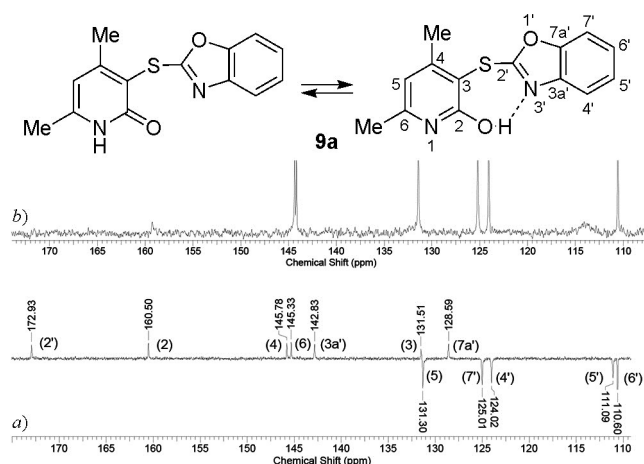


Рисунок 1. Спектры ЯМР  $^{13}\text{C}$  соединения **9a**, записанные в а)  $\text{CDCl}_3$  и б)  $\text{DMSO-}d_6$ .

интервалах 113.7–115.3 и 107.6–109.6 м. д. соответственно. В спектре ЯМР  $^1\text{H}$  соединения **9a** сигнал протона Н-5 наблюдается в более слабом поле при 6.63 м. д., по сравнению с сигналами этого же протона в спектрах соединений **8**, **10 a**, резонирующих при 5.92–6.19 м. д. Для соединений **8–10 a** также были зарегистрированы двумерные спектры  $^1\text{H-}^{13}\text{C}$  НМВС. Сигналы атомов С этих соединений были отнесены на основании корреляции с протонами метильных групп (1.74–2.53 м. д.) и протоном в положении С-5. В спектре  $^1\text{H-}^{13}\text{C}$  НМВС соединения **9a** отмечены кросс-пики  $^{13}\text{C}\{^1\text{H}\}$ : 128.6 {12.45}, 142.8 {12.45}, 160.5 {12.45} м. д., указывающие на взаимодействие протона группы OH пиридин-2-ола с атомами углерода С-7а, С-3а 1,3-бензоксазола и С-2 пиридин-2-она.

Таким образом, показано, что внутримолекулярная циклизация 2-(гетероарилсульфанил)-*N*-(3-оксоалкил)-ацетамидов приводит к пиридин-2(1*H*)-онам, содержащим в положении С-3 двухвалентный атом серы, связанный с гетероциклом. На примере 3-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)замещенных пиридин-2(1*H*)-онов изучены реакции алкилирования, бромирования, нитрования и разработан новый способ получения труднодоступных 3-сульфанилпиридин-2(1*H*)-онов.

#### Экспериментальная часть

ИК спектры зарегистрированы на фурье-спектрометре ФТ-801 в таблетках КВг. Спектры ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $^{13}\text{C}$  и двумерные спектры  $^1\text{H-}^{13}\text{C}$  НМВС записаны на приборе Bruker DRX 400 (400 и 100 МГц соответственно), внутренний стандарт ТМС. Спектры ЯМР  $^{13}\text{C}$  записаны в режиме *J*-модуляции. Элементный анализ выполнен на CHN-анализаторе Carlo Erba 1106. Температуры плавления определены на столике Кофлера и на приборе Reach devices RD-MP. Контроль за ходом реакций и чистотой полученных соединений осуществлен методом ТСХ на пластинах Sorbfil UV-254, проявление в УФ свете. Очистка колоночной хроматографией проведена с использованием силикагеля в качестве сорбента.

Синтез исходных *N*-[(1*Z*)-3-оксоалкил-1-ен-1-ил]-2-хлорацетамидов **1a–c** описан нами ранее.<sup>24</sup>

**Получение 2-(гетероарилсульфанил)-*N*-[(1*Z*)-3-оксоалк-1-ен-1-ил]ацетамидов 5а–с, 6а, 7а** (общая методика). Раствор 1.0 ммоль соединения 1а–с, 207 мг (1.5 ммоль)  $K_2CO_3$ , 1.0 ммоль соединения 2–4 и 17 мг (0.1 ммоль) KI в 3 мл абсолютного  $Me_2CO$  перемешивают при комнатной температуре в течение 2–4 ч. Растворитель удаляют при пониженном давлении. Осадок обрабатывают 10 мл  $H_2O$  и нейтрализуют 5% водным раствором  $AsOH$ , фильтруют, промывают  $H_2O$  и кристаллизуют из системы  $EtOH-H_2O$ .

**(*Z*)-2-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-*N*-(4-оксопент-2-ен-2-ил)ацетамид (5а)**. Выход 276 мг (90%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. 112–113 °C ( $EtOH-H_2O$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1592 (NC=O), 1649 (C=O), 1698 (C=O), 3200–3645 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 2.13 (3H, с,  $COCH_3$ ); 2.37 (3H, д,  $^4J = 1.0$ , =C– $CH_3$ ); 4.19 (2H, с,  $SCH_2$ ); 5.36 (1H, к,  $^4J = 1.0$ , =CH); 7.27–7.32 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.38–7.43 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.73–7.77 (1H, м, Н-7 бензотиазол); 7.88–7.92 (1H, м, Н-4 бензотиазол); 12.84 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}C$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д.: 21.8 ( $CH_3$ ); 30.5 ( $CH_3$ ); 37.8 ( $CH_2S$ ); 106.6 (=CH); 121.0 (C-7 бензотиазол); 121.9 (C-4 бензотиазол); 124.4 (C-6 бензотиазол); 126.0 (C-5 бензотиазол); 135.7 (C-7а бензотиазол); 154.0 (=C–NH); 152.8 (C-3а бензотиазол); 164.2 (C-2 бензотиазол); 167.3 (C=O); 199.4 (NC=O). Найдено, %: C 54.96; H 4.67; N 9.03.  $C_{14}H_{14}N_2O_2S_2$ . Вычислено, %: C 54.88; H 4.61; N 9.14.

**(*Z*)-2-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-*N*-(4-оксо-4-фенилбут-2-ен-2-ил)ацетамид (5b)**. Выход 283 мг (77%), бледно-желтый порошок, т. пл. 80–81 °C ( $EtOH-H_2O$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1600 (NC=O), 1622 (C=O), 1699 (C=O), 3305–3628 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 2.51 (3H, д,  $^4J = 1.0$ , =C $CH_3$ ); 4.46 (2H, с,  $SCH_2$ ); 6.07 (1H, к,  $^4J = 1.0$ , =CH); 7.24–7.30 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.34–7.40 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.41–7.46 (2H, м, Н-3,5 Ph); 7.50–7.54 (1H, м, Н-4 Ph); 7.72–7.75 (1H, м, Н-7 бензотиазол); 7.91–7.94 (1H, м, Н-4 бензотиазол); 7.87–7.90 (2H, м, Н-2,6 Ph); 13.26 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}C$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д.: 22.5 ( $CH_3$ ); 38.1 ( $CH_2S$ ); 102.9 (=CH); 121.0 (C-7 бензотиазол); 122.0 (C-4 бензотиазол); 124.5 (C-6 бензотиазол); 126.1 (C-5 бензотиазол); 127.8 (2C); 128.6 (C-2,3,5,6 Ph); 132.5 (C-4 Ph); 135.8 (C-7а бензотиазол); 138.6 (C-1 Ph); 152.9 (C-3а бензотиазол); 156.3 (=C–NH); 164.3 (C-2 бензотиазол); 167.5 (C=O); 191.2 (NC=O). Найдено, %: C 62.04; H 4.31; N 7.55.  $C_{19}H_{16}N_2O_2S_2$ . Вычислено, %: C 61.93; H 4.38; N 7.60.

***N*-(2-Ацетилциклогекс-1-ен-1-ил)-2-(1,3-бензотиазол-2-илсульфанил)ацетамид (5с)**. Выход 209 мг (60%), бледно-коричневые кристаллы, т. пл. 97–98 °C ( $EtOH-H_2O$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1576 (NC=O), 1634 (C=O), 1691 (C=O), 3305–3630 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 1.57–1.65 (4H, м,  $CH_2CH_2$ ); 2.19 (3H, с,  $COCH_3$ ); 2.34–2.42 (2H, м, =C $CH_2$ ); 2.95–3.02 (2H, м, =C $CH_2$ ); 4.16 (2H, с,  $SCH_2$ ); 7.25–7.31 (1H, с, Н-6 бензотиазол); 7.36–7.42 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.71–7.75 (1H, м, Н-7 бензотиазол); 7.87–7.91 (1H, м, Н-4 бензотиазол); 13.23 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}C$

( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д.: 21.5 ( $CH_2$ ); 22.0 ( $CH_2$ ); 26.5 ( $CH_2$ ); 28.5 ( $CH_2$ ); 28.9 ( $CH_3$ ); 38.3 ( $CH_2S$ ); 113.0 (=C); 121.0 (C-7 бензотиазол); 122.0 (C-4 бензотиазол); 124.4 (C-6 бензотиазол); 126.0 (C-5 бензотиазол); 135.7 (C-7а бензотиазол); 151.4 (C-3а бензотиазол); 153.0 (=C–NH); 164.7 (C-2 бензотиазол); 167.8 (C=O); 202.3 (NC=O). Найдено, %: C 59.06; H 5.31; N 7.99.  $C_{17}H_{18}N_2O_2S_2$ . Вычислено, %: C 58.93; H 5.24; N 8.09.

**(*Z*)-2-(1,3-Бензоксазол-2-илсульфанил)-*N*-(4-оксопент-2-ен-2-ил)ацетамид (6а)**. Выход 235 мг (81%), бледно-коричневые кристаллы, т. пл. 123–124 °C ( $EtOH-H_2O$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1600 (NC=O), 1647 (C=O), 1701 (C=O), 3276 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 2.13 (3H, с,  $COCH_3$ ); 2.38 (3H, д,  $^4J = 1.0$ , =C $CH_3$ ); 4.16 (2H, с,  $SCH_2$ ); 5.38 (1H, к,  $^4J = 1.0$ , =CH); 7.22–7.30 (2H, м, Н-5,6 бензоксазол); 7.42–7.748 (1H, м, Н-7 бензоксазол); 7.58–7.64 (1H, м, Н-4 бензоксазол); 12.85 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}C$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д.: 21.8 ( $CH_3$ ); 30.5 ( $CH_3$ ); 37.2 ( $CH_2S$ ); 106.8 (=CH); 110.1 (C-5 бензоксазол); 118.8 (C-6 бензоксазол); 124.2, 124.4 (C-4,7 бензоксазол); 141.8 (C-3а бензоксазол); 152.3 (C-3а бензоксазол); 154.1 (=C–NH); 162.9 (C-2 бензоксазол); 166.7 (C=O); 199.6 (NC=O). Найдено, %: C 57.81; H 4.97; N 9.65.  $C_{14}H_{14}N_2O_3S$ . Вычислено, %: C 57.92; H 4.86; N 9.56.

**(*Z*)-2-[(1-Метил-1*H*-бензимидазол-2-ил)сульфанил]-*N*-(4-оксопент-2-ен-2-ил)ацетамид (7а)**. Выход 201 мг (66%), бледно-коричневые кристаллы, т. пл. 127–128 °C ( $EtOH-H_2O$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1600 (NC=O), 1645 (C=O), 1701 (C=O), 3000–3350 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д. (*J*, Гц): 2.08 (3H, с,  $COCH_3$ ); 2.34 (3H, д,  $^4J = 1.0$ , =C $CH_3$ ); 3.37 (1H, с,  $NCH_3$ ); 4.25 (2H, с,  $SCH_2$ ); 5.32 (1H, к,  $^4J = 1.0$ , =CH); 7.17–7.29 (2H, м, Н-5,6 бензимидазол); 7.61–7.69 (2H, м, Н-4,7 бензимидазол); 12.76 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}C$  ( $CDCl_3$ ),  $\delta$ , м. д.: 21.8 ( $CH_3$ ); 30.1 ( $CH_3$ ); 30.4 ( $NCH_3$ ); 37.2 ( $CH_2S$ ); 106.6 (=CH); 108.5 (C-4 бензимидазол); 118.6 (C-7 бензимидазол); 121.8 (C-6 бензимидазол); 121.9 (C-5 бензимидазол); 137.2 (C-3а бензимидазол); 143.4 (C-3а бензимидазол); 150.0 (C-2 бензимидазол); 154.0 (=C–NH); 167.5 (C=O); 199.1 (NC=O). Найдено, %: C 59.46; H 5.76; N 13.72.  $C_{15}H_{17}N_3O_2S$ . Вычислено, %: C 59.38; H 5.65; N 13.85.

**Получение 3-(гетероарилсульфанил)пиридин-2(1*H*)-онов 8а–с, 10а и 3-(1,3-бензоксазол-2-илсульфанил)-4,6-диметилпиридин-2-ола (9а)** (общая методика). К раствору 1.0 ммоль ацетамида 5а–с, 7а, 6а, в 5 мл абсолютного ТГФ при перемешивании и охлаждении льдом добавляют 168 мг (1.5 ммоль) *t*-BuOK. Смесь перемешивают при охлаждении в течение 15 мин, а затем в течение 1 ч при комнатной температуре. Растворитель удаляют при пониженном давлении, остаток обрабатывают 5 мл  $H_2O$ , нейтрализуют 5% раствором  $AsOH$ , фильтруют, промывают  $H_2O$  и кристаллизуют из  $EtOH$ .

**3-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-4,6-диметилпиридин-2(1*H*)-он (8а)**. Выход 238 мг (88%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. >250 °C ( $EtOH$ ). ИК спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$ : 1649 (C=O), 3200–3300 (N–H). Спектр ЯМР  $^1H$

(ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.24 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.35 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.19 (1H, с, Н-5); 7.29 (1H, д,  $^3J = 7.8$ ,  $^3J = 7.4$ , Н-6 бензотиазол); 7.41 (1H, д,  $^3J = 8.0$ ,  $^3J = 7.4$ , Н-5 бензотиазол); 7.79 (1H, д,  $^3J = 8.0$ , Н-7 бензотиазол); 7.88 (1H, д,  $^3J = 7.8$ , Н-4 бензотиазол); 12.08 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 18.5 (CH<sub>3</sub>); 21.3 (CH<sub>3</sub>); 107.8 (C-5); 113.7 (C-3); 121.0 (C-7 бензотиазол); 121.5 (C-4 бензотиазол); 124.0 (C-6 бензотиазол); 126.2 (C-5 бензотиазол); 134.7 (C-7а бензотиазол); 148.7 (C-4); 153.8 (C-3а бензотиазол); 160.1 (C-6); 161.3 (C-2); 169.7 (C-2 бензотиазол). Найдено, %: С 58.24; Н 4.27; N 9.83. C<sub>14</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>OS<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 58.31; Н 4.19; N 9.71.

**3-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-6-метил-4-фенилпиридин-2(1H)-он (8b)**. Выход 210 мг (60%), бежевые кристаллы, т. пл. 205–206 °С (EtOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1640 (C=O), 3225–3660 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.33 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.26 (1H, с, Н-5); 7.26–7.35 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.35–7.40 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.37–7.46 (5H, м, Н Ph); 7.77 (1H, д,  $^3J = 8.0$ ; Н-7 бензотиазол); 7.91 (1H, д,  $^3J = 7.9$ , Н-4 бензотиазол); 12.35 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 18.6 (CH<sub>3</sub>); 107.3 (C-5); 112.9 (C-3); 121.0 (C-7 бензотиазол); 121.4 (C-4 бензотиазол); 124.0 (C-6 бензотиазол); 126.1 (C-5 бензотиазол); 127.8, 128.0 (C-2,3,5,6 Ph); 128.7 (C-4 Ph); 134.7 (C-7а бензотиазол); 138.5 (C-1 Ph); 149.3 (C-4); 153.5 (C-3а бензотиазол); 160.9 (C-6); 161.4 (C-2); 169.5 (C-2а бензотиазол). Найдено, %: С 64.99; Н 4.11; N 8.08. C<sub>19</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>OS<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 65.12; Н 4.03; N 8.53.

**3-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-4-метил-5,6,7,8-тетрагидрохинолин-2(1H)-он (8c)**. Выход 259 мг (78%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. 147–148 °С (EtOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1638 (C=O), 3250–3600 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 1.46–1.54 (2H, м, 7-CH<sub>2</sub>); 1.62–1.71 (2H, м, 6-CH<sub>2</sub>); 2.41(3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.37–2.45 (4H, м, 5,8-CH<sub>2</sub>); 7.21–7.26 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.38–7.45 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.64 (1H, д,  $^3J = 8.0$ , Н-7 бензотиазол); 7.85 (1H, д,  $^3J = 7.9$ , Н-4 бензотиазол); 12.98 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ , м. д.: 18.5 (CH<sub>3</sub>); 21.0 (CH<sub>2</sub>); 22.5 (CH<sub>2</sub>); 25.0 (CH<sub>2</sub>); 27.3 (CH<sub>2</sub>); 115.3 (C-5); 116.1 (C-3); 120.7 (C-7 бензотиазол); 121.8 (C-4 бензотиазол); 124.0 (C-6 бензотиазол); 125.9 (C-5 бензотиазол); 135.7 (C-7а бензотиазол); 146.3 (C-4); 154.2 (C-3а бензотиазол); 160.1 (C-6); 162.6 (C-2); 169.4 (C-2а бензотиазол). Найдено, %: С 62.03; Н 4.83; N 8.61. C<sub>17</sub>H<sub>16</sub>N<sub>2</sub>OS<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 62.16; Н 4.91; N 8.53.

**3-(1,3-Бензоксазол-2-илсульфанил)-4,6-диметилпиридин-2-ол (9a)**. Выход 68 мг (25 %), бежевые кристаллы, т. пл. >250 °С. ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1607 (Ar), 3273 (O–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.44 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.53 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.63 (1H, с, Н-5); 7.16–7.27 (3H, м, Н-6 бензоксазол); 7.35–7.45 (1H, м, Н-6 бензоксазол); 12.30 (1H, уш. с, OH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (CDCl<sub>3</sub>, –35 °С),  $\delta$ , м. д.: 15.8 (CH<sub>3</sub>); 16.5 (CH<sub>3</sub>); 110.6 (C-6 бензоксазол); 111.1 (C-5 бензоксазол); 124.0 (C-4 бензоксазол); 125.0 (C-7 бензоксазол); 128.6 (C-7а бензоксазол); 131.3 (C-5); 131.5 (C-3); 142.8 (C-3а бенз-

оксазол); 145.3 (C-6); 145.8 (C-4); 160.5 (C-2); 172.9 (C-2 бензоксазол). Найдено, %: С 61.60; Н 4.51; N 10.36. C<sub>14</sub>H<sub>12</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S. Вычислено, %: С 61.75; Н 4.44; N 10.29.

**4,6-Диметил-3-[(1-метил-1H-бензимидазол-2-ил)-сульфанил]пиридин-2(1H)-он (10a)**. Выход 77 мг (70%), бежевые кристаллы, т. пл. >250 °С (EtOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1634 (C=O), 3305–3645 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 1.74 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.44 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 3.90 (3H, с, NCH<sub>3</sub>); 5.92 (1H, с, Н-5); 7.16–7.30 (3H, м, Н-4,5,6 бензимидазол); 7.65 (1H, д,  $^3J = 7.4$ , Н-7 бензимидазол); 12.92 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (CDCl<sub>3</sub>),  $\delta$ , м. д.: 18.0 (CH<sub>3</sub>); 22.0 (CH<sub>3</sub>); 30.8 (NCH<sub>3</sub>); 108.8 (C-4 бензимидазол); 109.6 (C-5); 115.3 (C-3); 119.1 (C-7 бензимидазол); 121.7 (C-5 бензимидазол); 122.1 (C-6 бензимидазол); 136.3 (C-7а бензимидазол); 143.3 (C-3а бензимидазол); 145.6 (C-6); 149.5 (C-2 бензимидазол); 157.5 (C-4); 163.5 (C-2). Найдено, %: С 63.03; Н 5.39; N 14.42. C<sub>15</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>OS. Вычислено, %: С 63.13; Н 5.30; N 14.37.

**3-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-1,4,6-триметилпиридин-2(1H)-он (11a)**. К раствору 288 мг (1 ммоль) соединения **8a**, 110 мкл (1.75 ммоль) иодистого метила и 0.1 мг (50 мкмоль) иодида тетраметиламмония в 2.0 мл ТГФ при перемешивании и охлаждении льдом добавляют 168 мг (1.5 ммоль) *t*-BuOK. Смесь перемешивают в течение 3 ч при комнатной температуре, затем выливают в H<sub>2</sub>O, нейтрализуют, экстрагируют CHCl<sub>3</sub> (3 × 5 мл), CHCl<sub>3</sub> удаляют при пониженном давлении, остаток очищают колоночной хроматографией (силикагель 60–100 мкм, элюент CHCl<sub>3</sub>–EtOAc, 1:1). Выход 179 мг (59%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. >250 °С. ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1642 (C=O). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.40 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.42 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 3.57 (3H, с, NCH<sub>3</sub>); 6.13 (1H, с, Н-5); 7.19–7.25 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.33–7.37 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.61–7.65 (1H, д,  $^3J = 8.0$ , Н-7 бензотиазол); 7.82–7.85 (1H, д,  $^3J = 7.9$ , Н-4 бензотиазол). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 21.1 (CH<sub>3</sub>); 21.7 (CH<sub>3</sub>); 32.3 (NCH<sub>3</sub>); 109.6 (C-5); 115.8 (C-3); 120.7 (C-7 бензотиазол); 121.8 (C-4 бензотиазол); 123.9 (C-6 бензотиазол); 125.8 (C-5 бензотиазол); 135.6 (C-3а бензотиазол); 148.6 (C-4); 154.2 (C-3а бензотиазол); 157.8 (C-6); 162.2 (C-2); 168.8 (C-2 бензотиазол). Найдено, %: С 59.49; Н 4.37; N 9.31. C<sub>15</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>OS<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 59.57; Н 4.67; N 9.26.

**3-(1,3-Бензотиазол-2-илсульфанил)-5-бром-4,6-диметилпиридин-2(1H)-он (12a)**. К раствору 288 мг (1.0 ммоль) соединения **8a** в 6 мл диоксана добавляют раствор 248 мг (1.0 ммоль) Br<sub>2</sub> в 6 мл диоксана. Смесь перемешивают при комнатной температуре до завершения реакции (контроль методом ТСХ, 8–10 ч), затем выливают в ледяную H<sub>2</sub>O и нейтрализуют 2 н. водным раствором NaHCO<sub>3</sub>. Осадок фильтруют, промывают H<sub>2</sub>O и кристаллизуют из EtOH. Выход 258 мг (70%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. >250 °С (EtOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1647 (C=O), 3200–3650 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц): 2.44 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.59 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 7.31–7.34 (1H, м, Н-5 бензотиазол); 7.42–7.46 (1H, м, Н-6 бензотиазол); 7.82 (1H, д,  $^3J = 8.0$ , Н-4 бензотиазол); 7.92 (1H, д,  $^3J = 7.9$ ,

H-7 бензотиазол); 12.59 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 20.7 (CH<sub>3</sub>); 23.3 (CH<sub>3</sub>); 99.4 (C-5); 121.1 (C-7 бензотиазол); 121.5 (C-4 бензотиазол); 124.1 (C-6 бензотиазол); 126.2 (C-5 бензотиазол); 134.7 (C-3, C-3 бензотиазол); 153.6 (C-4, C-7а бензотиазол); 158.2 (C-6); 159.8 (C-2); 168.3 (C-2 бензотиазол). Найдено, %: С 45.84; Н 2.98; N 7.71. C<sub>14</sub>H<sub>11</sub>BrN<sub>2</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 45.78; Н 3.02; N 7.63.

**4,6-Диметил-3-[(6-нитро-1,3-бензотиазол-2-ил)-сульфанил]пиридин-2(1H)-он (13a).** К раствору 288 мг (1.0 ммоль) соединения **8a** в 3 мл концентрированной H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> добавляют 252 мг (2.5 ммоль) KNO<sub>3</sub>. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 4 ч, затем выливают в лед и нейтрализуют 2 н. водным раствором NaHCO<sub>3</sub>. Осадок отфильтровывают, промывают H<sub>2</sub>O и кристаллизуют из AcOH. Выход 165 мг (49%), желтые кристаллы, т. пл. >250 °С (AcOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1332 (NO<sub>2</sub>), 1515 (NO<sub>2</sub>), 1656 (C=O), 3305–3677 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. (J, Гц): 2.27 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.38 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.25 (1H, с, H-5); 7.96 (1H, д,  $^3J = 9.0$ , H-4 бензотиазол); 8.27 (1H, д,  $^3J = 9.0$ ,  $^4J = 2.5$ , H-5 бензотиазол); 8.94 (1H, д,  $^4J = 2.5$ , H-7 бензотиазол); 12.18 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 18.5 (CH<sub>3</sub>); 21.2 (CH<sub>3</sub>); 107.9 (C-5); 112.9 (C-3); 118.4 (C-4 бензотиазол); 121.1, 121.8 (C-5,7 бензотиазол); 135.3 (C-7а бензотиазол); 143.3 (C-6 бензотиазол); 149.3 (C-4); 157.7 (C-3а бензотиазол); 160.4 (C-6); 161.1 (C-2); 177.5 (C-2 бензотиазол). Найдено, %: С 50.52; Н 3.27; N 12.71. C<sub>14</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 50.44; Н 3.33; N 12.60.

**4,6-Диметил-5-нитро-3-[(6-нитро-1,3-бензотиазол-2-ил)сульфанил]пиридин-2(1H)-он (14a).** Смесь 0.4 мл дымящей HNO<sub>3</sub> и 0.6 мл концентрированной H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> добавляют по каплям к раствору 288 мг (1.0 ммоль) соединения **8a** в 1 мл концентрированной H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> при –3 °С. Смесь перемешивают в течение 1 ч при комнатной температуре, затем выливают в лед и нейтрализуют 2 н. водным раствором NaHCO<sub>3</sub>. Осадок отфильтровывают, промывают H<sub>2</sub>O и кристаллизуют из AcOH. Выход 179 мг (59%), бледно-желтые кристаллы, т. пл. >250 °С (AcOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1332 (NO<sub>2</sub>), 1515 (NO<sub>2</sub>), 1656 (C=O), 3305–3670 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. (J, Гц): 2.46 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.51 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 8.01 (1H, д,  $^3J = 9.0$ , H-4 бензотиазол); 8.29 (1H, д,  $^3J = 9.0$ ,  $^4J = 2.4$ , H-5 бензотиазол); 9.01 (1H, д,  $^4J = 2.4$ , H-7 бензотиазол); 13.01 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 17.0 (CH<sub>3</sub>); 18.4 (CH<sub>3</sub>); 118.6 (C-4 бензотиазол); 121.5, 121.9 (5,7-CH бензотиазол); 135.2 (C-3); 135.4 (C-7а бензотиазол); 143.6 (C-6 бензотиазол); 148.0 (C-4); 152.0 (C-5); 157.3 (C-3а бензотиазол); 159.3 (C-6); 171.9 (C-2); 177.8 (C-2 бензотиазол). Найдено, %: С 44.56; Н 2.54; N 14.81. C<sub>14</sub>H<sub>10</sub>N<sub>4</sub>O<sub>5</sub>S<sub>2</sub>. Вычислено, %: С 44.44; Н 2.54; N 14.92.

**Получение 3-сульфанилпиридин-2(1H)-онов 15a–c** (общая методика). К раствору 1.0 ммоль соединения **8a–c** в 8.0 мл AcOH добавляют 317 мг (5.0 ммоль) активированной цинковой пыли. Смесь кипятят в течение 2 ч, охлаждают и фильтруют от остатков цинка. Фильтрат нейтрализуют 2 н. водным раствором NaHCO<sub>3</sub>,

выпавший осадок отфильтровывают, промывают H<sub>2</sub>O и кристаллизуют из EtOH.

**4,6-Диметил-3-сульфанилпиридин-2(1H)-он (15a).** Выход 132 мг (85%), бледно-желтый порошок, т. пл. >250 °С (EtOH). ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1634 (C=O), 3150–3300 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 2.22 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 2.25 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.31 (1H, с, H-5); 12.61 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 17.7 (CH<sub>3</sub>); 22.2 (CH<sub>3</sub>); 111.8 (CH); 130.6 (C); 134.6 (C); 148.2 (C); 164.2 (C). Найдено, %: С 54.02; Н 5.86; N 9.13. C<sub>7</sub>H<sub>9</sub>NOS. Вычислено, %: С 54.17; Н 5.84; N 9.02.

**6-Метил-3-сульфанил-4-фенилпиридин-2(1H)-он (15b).** Выход 150 мг (69%), желтый порошок, т. пл. >250 °С. ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1628 (C=O), 3150–3300 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д. (J, Гц): 2.25 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 6.32 (1H, с, H-5); 7.35 (1H, т,  $^3J = 7.2$ , H-4 Ph); 7.42 (2H, д,  $^3J = 7.2$ ,  $^3J = 7.2$ ; H-3,5 Ph); 7.61 (2H, д,  $^3J = 7.2$ , H-2,6 Ph); 12.75 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 17.8 (CH<sub>3</sub>); 111.3 (CH); 127.7 (CH); 127.8 (2CH); 128.5 (2CH); 130.7 (C); 135.2 (C); 140.6 (C); 149.2 (C); 165.2 (C). Найдено, %: С 54.02; Н 5.91; N 9.13. C<sub>12</sub>H<sub>11</sub>NOS. Вычислено, %: С 54.17; Н 5.84; N 9.02.

**4-Метил-3-сульфанил-5,6,7,8-тетрагидрохинолин-2(1H)-он (15c).** Выход 123 г (63%), бледно-желтый порошок, т. пл. >250 °С. ИК спектр,  $\nu$ , см<sup>-1</sup>: 1632 (C=O), 3200–3350 (N–H). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 1.95–1.97 (4H, м, 6,7-CH<sub>2</sub>); 2.63–2.80 (7H, м, 5,8-CH<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>); 12.66 (1H, уш. с, NH). Спектр ЯМР  $^{13}\text{C}$  (ДМСО- $d_6$ ),  $\delta$ , м. д.: 18.2 (CH<sub>3</sub>); 21.0 (CH<sub>2</sub>); 21.9 (CH<sub>2</sub>); 24.3 (CH<sub>2</sub>); 25.9 (CH<sub>2</sub>); 117.1 (CH); 131.2 (C); 132.9 (C-4); 147.7 (C-6); 162.5 (C-2). Найдено, %: С 61.61; Н 6.66; N 7.23. C<sub>10</sub>H<sub>13</sub>NOS. Вычислено, %: С 61.50; Н 6.71; N 7.17.

*Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (грант 19-13-00273).*

#### Список литературы

- Smith, K.; Anderson, D.; Matthews, I. *J. Org. Chem.* **1996**, *61*, 662.
- Hoffman, J. M.; Smith, A. M.; Rooney, C. S.; Fisher, T. E.; Wai, J. S.; Thomas, C. M.; Bamberger, D. L.; Barnes, J. L.; Williams, T. M.; Jones, J. H.; Olson, B. D.; O'Brien, J. A.; Goldman, M. E.; Nunberg, J. H.; Quintero, J. C.; Schleif, W. A.; Emini, E. A.; Anderson, P. S. *J. Med. Chem.* **1993**, *36*, 953.
- Boy, K. M.; Hewawasam, P.; Sit, S.-Y.; Xie, K. US Patent 7049309.
- Boy, K. M.; Hewawasam, P.; Sit, S.-Y. US Patent 2005/0080105
- Boy, K. M.; Guernon, J. M.; Sit, S.-Y.; Xie, K.; Hewawasam, K. P.; Boissard, C. G.; Dworetzky, S. I.; Natale, J.; Gribkoff, V. K.; Lodge, N.; Starrett, J. E., Jr. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 5089.
- Hewawasam, P.; Fan, W.; Cook, D. A.; Newberry, K. S.; Boissard, C. G.; Gribkoff, V. K.; Starrett, J.; Lodge, N. *J. Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2004**, *14*, 4479
- Reich, S. H.; Sprengeler, P. A.; Webber, S. E.; Xiang, A. X.; Ernst, J. T. WO Patent 2015/200481.
- Taldone, T.; Kang, Y.; Patel, H. J.; Patel, M. R.; Patel, P. D.; Rodina, A.; Patel, Y.; Gozman, A.; Maharaj, R.; Clement, C. C.; Lu, A.; Young, J. C.; Chiosis, G. *J. Med. Chem.* **2014**, *57*, 1208.

9. Prabhakar, B. S.; Elshabrawy, H. A. WO Patent 2013/152223.
10. Kim, A. R.; Lin, H. N. *RCS Adv.* **2020**, 10, 7855.
11. Das, D.; Mukherjee, P.; Das, A. R. *ChemistrySelect* **2019**, 4, 1971.
12. Guo, T.; Wang, H.; *Synlett* **2017**, 1845.
13. Guo, T.; Wei, X.-N. *Synlett* **2017**, 2499.
14. Hamama, W. S.; Hassani, A. E.; El-Fedawy, M. G.; Zoorob, H. H. *J. Heterocycl. Chem.* **2015**, 52, 492.
15. Nikama, B. P.; Kappe, T. *J. Heterocycl. Chem.* **2017**, 54, 1757.
16. Paul, S.; Shrestha, R.; Edison, T. N. J. I.; Lee, Y. R.; Kim, S. H. *Adv. Synth. Catal.* **2016**, 358, 3050.
17. Hua, J.; Fang, Z.; Xu, J.; Bian, M.; Liu, C. K.; He, W.; Zhu, N.; Yang, Z.; Guo, K. *Green Chem.* **2019**, 21, 4706.
18. Gao, W.-C.; Liu, T.; Cheng, Yu-F.; Chang, H.-H.; Li, X.; Zhou, R.; Wei, W.-L.; Qiao, Y. *J. Org. Chem.* **2017**, 82, 13459.
19. Zhang, R.; Jin, S.; Wan, Yu.; Lin, S.; Yan, Z. *Tetrahedron Lett.* **2018**, 59, 841.
20. Benjahad, A.; Oumouch, S.; Guillemont, J.; Pasquier, E.; Mabire, D.; Andries, K.; Nguyen, C. H.; Grierson, D. S. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2007**, 17, 712.
21. Tada, Y.; Iso, Y.; Hanasaki, K. US Patent 2004/0082619
22. Kononov, A. I.; Antipin, I. S.; Burilov, V. A.; Madzhidov, T. I.; Kurbangalieva, A. R.; Nemtarev, A. V.; Solovieva, S. E.; Stoikov, I. I.; Mamedov, V. A.; Zakharova, L. Ya.; Gavrilova, E. L.; Sinyashin, O. G.; Balova, I. A.; Vasilyev, A. V.; Zenkevich, I. G.; Krasavin, M. Yu.; Kuznetsov, M. A.; Molchanov, A. P.; Novikov, M. S.; Nikolaev, V. A.; Rodina, L. L.; Khlebnikov, A. F.; Beletskaya, I. P.; Vatsadze, S. Z.; Gromov, S. P.; Zyk, N. V.; Lebedev, A. T.; Lemenovskii, D. A.; Petrosyan, V. S.; Nenaidenko, V. G.; Negrebetskii, V. V.; Baukov, Yu. I.; Shmigol', T. A.; Korlyukov, A. A.; Tikhomirov, A. S.; Shchekotikhin, A. E.; Traven', V. F.; Voskresenskii, L. G.; Zubkov, F. I.; Golubchikov, O. A.; Semeikin, A. S.; Berezin, D. B.; Stuzhin, P. A.; Filimonov, V. D.; Krasnokutskaya, E. A.; Fedorov, A. Yu.; Nyuchev, A. V.; Orlov, V. Yu.; Begunov, R. S.; Rusakov, A. I.; Kolobov, A. V.; Kofanov, E. R.; Fedotova, O. V.; Egorova, A. Yu.; Charushin, V. N.; Chupakhin, O. N.; Klimochkin, Yu. N.; Osyanin, V. A.; Reznikov, A. N.; Fisyuk, A. S.; Sagitullina, G. P.; Aksenov, A. V.; Aksenov, N. A.; Grachev, M. K.; Maslennikova, V. I.; Koroteev, M. P.; Brel', A. K.; Lisina, S. V.; Medvedeva, S. M.; Shikhaliev, Kh. S.; Suboch, G. A.; Tovbis, M. S.; Mironovich, L. M.; Ivanov, S. M.; Kurbatov, S. V.; Kletskii, M. E.; Burov, O. N.; Kobrakov, K. I.; Kuznetsov, D. N. *Russ. J. Org. Chem.* **2018**, 54, 157. [*Журн. орган. химии* **2018**, 54, 161.]
23. Goncharov, D. S.; Kulakov, I. V.; Fisyuk, A. S. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2017**, 53, 1335. [*Химия гетероцикл. соединений* **2017**, 53, 1335.]
24. Fisyuk, A. S.; Kulakov, I. V.; Goncharov, D. S.; Nikitina, O. S.; Bogza, Y. P.; Shatsauskas, A. L. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2014**, 50, 217. [*Химия гетероцикл. соединений* **2014**, 241.]
25. Fisyuk, A. S.; Poendaev, N. V. *Molecules* **2002**, 7, 124.
26. Kulakov, I. V.; Nikitina, O. S.; Fisyuk, A. S.; Goncharov, D. S.; Shul'gau, Z. T.; Gulyaev, A. E. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2014**, 50, 670. [*Химия гетероцикл. соединений* **2014**, 729.]
27. Fisyuk, A. S.; Bogza, Y. P.; Poendaev, N. V.; Goncharov, D. S. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2010**, 46, 844. [*Химия гетероцикл. соединений* **2010**, 1044.]
28. Goncharov, D. S.; Kostuchenko, A. S.; Fisyuk, A. S. *Chem. Heterocycl. Compd.* **2009**, 45, 793. [*Химия гетероцикл. соединений* **2009**, 1005.]
29. Fisyuk, A. S.; Bundel', Yu. G. *Chem. Heterocycl. Compd.* **1999**, 35, 125. [*Химия гетероцикл. соединений* **1999**, 147.]
30. Goncharov, D. S.; Garkushenko, A. K.; Savelieva, A. P.; Fisyuk, A. S. *ARKIVOC* **2015**, (v), 176.
31. Fisyuk, A. S.; Vorontsova, M. A.; Temnikov, D. V. *Tetrahedron Lett.* **1996**, 37, 5203.
32. Fisyuk, A. S.; Berdovich, L. V.; Temnikov, D. V.; Knyaz'kova, L. N. *Chem. Heterocycl. Compd.* **1997**, 33, 805. [*Химия гетероцикл. соединений* **1997**, 921.]
33. Поендаев, Н. В. Автореф. дис. к. х. н.; Тюмень, 1999.
34. Liu, Y.; Xie, Z.; Zhao, D.; Zhu, J.; Mao, F.; Tang, Sh.; Xu, H.; Luo, Ch.; Geng, M.; Huang, M.; Lia, J. *J. Med. Chem.* **2017**, 60, 2227.
35. Chourasiya, S. S.; Kathuria, D.; Singh, Sh.; Sonawane, V. C.; Chakraborti, A. K.; Bharatam, P. V. *RSC Adv.* **2015**, 5, 80027.
36. Prezent, M. A.; Dorokhov, V. A. *Russ. Chem. Bull., Int. Ed.* **2003**, 52, 2454.
37. Katritzky, A. R.; Aurrecoechea, J. M.; Vazquez De Miguel, L. *Heterocycles* **1987**, 26, 427.
38. Katritzky, A. R.; Lagovski, J. M. *Adv. Heterocycl. Chem.* **1963**, 1, 339.
39. Oki, M. *Application of Dynamic NMR Spectroscopy to Organic Chemistry*; VCH Publishers, 1985.