

Е. С. Костенко, М. М. Липунов, Е. А. Кайгородова<sup>а</sup>,  
Л. Д. Конюшкин<sup>б</sup>

**СИНТЕЗ И РЕАКЦИОННАЯ СПОСОБНОСТЬ  
3-АМИНО-7-МЕТИЛ-9-МЕТОКСИМЕТИЛ-3,4-ДИГИДРОПИРИДО-  
[3',2':4,5]ТИЕНО[3,2-*d*]ПИРИМИДИН-4-ОНОВ**

Реакцией ацилпроизводных этил-3-аминотиено[2,3-*b*]пиридин-2-карбоксилата с гидразингидратом синтезирована серия трициклических 3-амино-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]-тиено[3,2-*d*]пириимидин-4-онов, содержащих в положении 2 алифатические, ароматические или гетероароматические фрагменты. Исследовано взаимодействие полученных 3-аминопиридоотиено[3,2-*d*]пириимидин-4-онов с альдегидами, формамидом, 2,5-диметокситетрагидрофураном, уксусным ангидридом и никелем Ренея.

**Ключевые слова:** 3-амино-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пириимидин-4-оны, гидразингидрат, этил-3-аминотиенопиридинкарбоксилат, десульфуризация, никель Ренея.

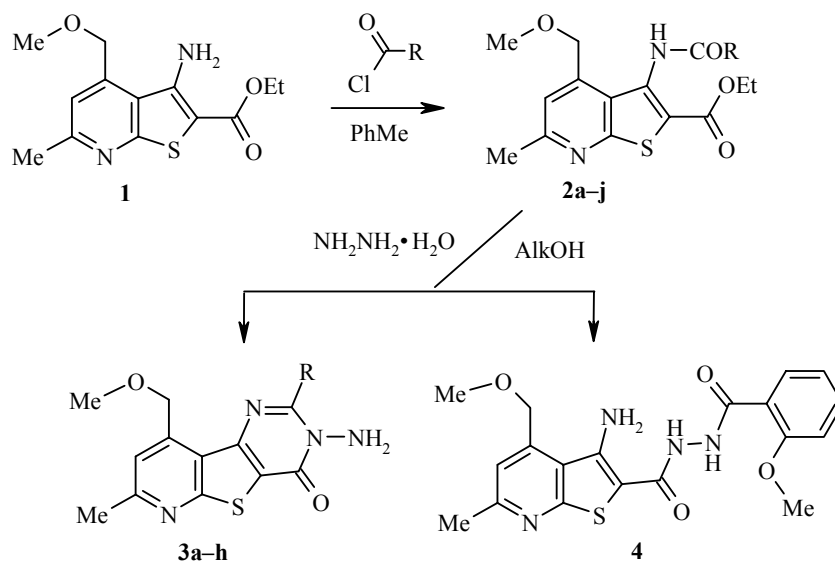
Интерес к 3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пириимидин-4-онам обусловлен наличием у соединений данного ряда фармакологической активности: анальгетической [1, 2], противовоспалительной [2], антимикробной [3]. Этим же объясняется и большое количество публикаций, посвященных синтезу данных соединений.

Наиболее распространенным методом их синтеза является реакция пиридоотиенооксазинов различного строения с гидразингидратом [1, 4–7]. Также применяются и другие подходы: взаимодействие гидразингидрата с этил-3-метилкарбоксамидотиено[2,3-*b*]пиридин-2-карбоксилатом [4] или же с этил-3-[(*E*)-1-этоксиметилиденамино]тиено[2,3-*b*]пиридин-2-карбоксилатом [7]. Тем не менее, ни один из этих способов не позволяет варьировать заместители в положении 2 пириимидинового цикла, что может быть важно при синтезе потенциально биологически активных веществ.

Нами предложен двустадийный синтез 3-амино-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пириимидин-4-онов, позволяющий вводить различные заместители во второе положение пириимидинового цикла: (схема 1): 1) взаимодействием этил-3-аминотиенопиридинкарбоксилата [8] **1** с хлорангидридами карбоновых кислот получены амиды **2a–j** с выходом 56–94%; 2) кипячение амидов **2a–e, g–i** с пятикратным избытком гидразингидрата в спирте (EtOH, *i*-PrOH, BuOH) приводит к соответствующим пириимидинонам **3a–h** (выход 42–84%) (табл. 1).

Установлено, что при введении в реакцию с гидразингидратом соединения **2f** вместо замыкания цикла на стадии образования гидразида происходит реакция переацилирования последнего по группе NH<sub>2</sub> гидразинового фрагмента с образованием ярко-желтого гидразида **4** с выходом 44%.

Схема 1



**2, 3 a** R = Et, **b** R = *n*-Bu, **c** R = *i*-Bu, **d** R = Fur, **e** R = Ph,  
**2f** R = 2-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, **2g, 3f** R = 4-MeOC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, **2h, 3g** R = 2-O<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>,  
**2i, 3h** R = 4-O<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, **2j** R = 2-MeC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; Alk = Et, *i*-Pr, *n*-Bu

При попытке синтеза 3-аминопиримидинона, содержащего в качестве заместителя в положении 2 *o*-толил, даже при длительном кипячении был выделен исходный амид **2j**.

Амиды **2** и пиримидиноны **3** представляют собой бесцветные кристаллические вещества.

В ИК спектрах амидов **2a-j** наблюдается одна полоса валентных колебаний группы NH в области 3320–3140 см<sup>-1</sup>, а также полосы колебаний двух карбонильных групп: сложноэфирной в области 1725–1685 и амидной в области 1680–1640 см<sup>-1</sup> (табл. 2). Сигнал протона, прописывающийся в спектрах ЯМР <sup>1</sup>H соединений **2** в области 9.66–10.72 м. д., отнесен к амидной группе.

ИК спектры соединений **3a-h** отличаются от спектров исходных амидов наличием двух полос валентных колебаний в области 3325–3265 и 3230–3170 см<sup>-1</sup>, принадлежащих аминогруппе N–NH<sub>2</sub>-фрагмента, и только одной полосы эндоциклической карбонильной группы в области 1690–1655 см<sup>-1</sup>. В спектрах ЯМР <sup>1</sup>H соединений **3** в отличие от спектров исходных амидов **2** отсутствуют сигналы этильного радикала в сильном поле и появляется сигнал протонов группы NH<sub>2</sub> в области 5.66–6.02 м. д.

ИК и ЯМР <sup>1</sup>H спектры гидразида **4** кардинально отличаются как от спектров исходного амида **2f**, так и от спектров 3-аминопиридотиено[3,2-*d*]-пиримидин-4-онов **3a-h**. В ИК спектрах имеются три ярко выраженные полосы колебаний в области 3405–3315 см<sup>-1</sup>, которые относятся к валентным колебаниям связи N–H амино- и гидразидной групп, а также интенсивная полоса валентных колебаний карбонильной группы νC=O

Т а б л и ц а 1

**Характеристики синтезированных соединений 2–10**

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %			Т. пл., °С	Выход, %
		С	Н	N		
1	2	3	4	5	6	7
<b>2a</b>	C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	<u>57.18</u>	<u>5.95</u>	<u>8.29</u>	109–110	89
		57.13	5.99	8.33		
<b>2b</b>	C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	<u>59.30</u>	<u>6.70</u>	<u>7.74</u>	111–112	94
		59.32	6.64	7.69		
<b>2c</b>	C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	<u>59.26</u>	<u>6.71</u>	<u>7.65</u>	125–126	81
		59.32	6.64	7.69		
<b>2d</b>	C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	<u>57.78</u>	<u>4.80</u>	<u>7.53</u>	97–98	87
		57.74	4.85	7.48		
<b>2e</b>	C <sub>20</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	<u>62.44</u>	<u>5.30</u>	<u>7.26</u>	110–111	93
		62.48	5.24	7.29		
<b>2f</b>	C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	<u>60.92</u>	<u>5.31</u>	<u>6.79</u>	136–137	94
		60.85	5.35	6.76		
<b>2g</b>	C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	<u>60.93</u>	<u>5.29</u>	<u>6.80</u>	144–145	75
		60.85	5.35	6.76		
<b>2h</b>	C <sub>20</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S	<u>55.99</u>	<u>4.40</u>	<u>9.85</u>	199–200	81
		55.94	4.46	9.78		
<b>2i</b>	C <sub>20</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S	<u>56.00</u>	<u>3.99</u>	<u>9.83</u>	187–188	67
		55.94	4.46	9.78		
<b>2j</b>	C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S	<u>63.37</u>	<u>5.49</u>	<u>6.98</u>	144–145	56
		63.30	5.56	7.03		
<b>3a</b>	C <sub>14</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>55.21</u>	<u>5.37</u>	<u>18.37</u>	275–276	84
		55.25	5.30	18.41		
<b>3b</b>	C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>57.77</u>	<u>6.12</u>	<u>16.80</u>	166–167	83
		57.81	6.06	16.85		
<b>3c</b>	C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>57.78</u>	<u>6.02</u>	<u>16.89</u>	196–197	80
		57.81	6.06	16.85		
<b>3d</b>	C <sub>16</sub> H <sub>14</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>56.10</u>	<u>4.17</u>	<u>16.32</u>	272–273	42
		56.13	4.12	16.36		
<b>3e</b>	C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>61.39</u>	<u>4.51</u>	<u>15.98</u>	249–250	58
		61.35	4.58	15.90		
<b>3f</b>	C <sub>19</sub> H <sub>18</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>59.72</u>	<u>4.69</u>	<u>14.60</u>	229–230	49
		59.67	4.74	14.65		
<b>3g</b>	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S	<u>54.47</u>	<u>3.77</u>	<u>17.56</u>	256–257	54
		54.40	3.80	17.62		
<b>3h</b>	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S	<u>54.35</u>	<u>3.84</u>	<u>17.59</u>	>300	56
		54.40	3.80	17.62		
<b>4</b>	C <sub>19</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	<u>56.70</u>	<u>5.12</u>	<u>14.05</u>	215–216	44
		56.99	5.03	13.99		
<b>5a</b>	C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>66.27</u>	<u>6.09</u>	<u>12.92</u>	183–184	80
		66.33	6.03	12.89		
<b>5b</b>	C <sub>24</sub> H <sub>26</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>63.95</u>	<u>5.97</u>	<u>12.38</u>	221–222	98
		63.98	5.82	12.43		
<b>5c</b>	C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>64.70</u>	<u>6.05</u>	<u>11.98</u>	170–171	84
		64.63	6.07	12.06		
<b>5d</b>	C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S	<u>59.39</u>	<u>4.90</u>	<u>15.00</u>	217–218	77
		59.34	4.98	15.04		

Окончание таблицы 1

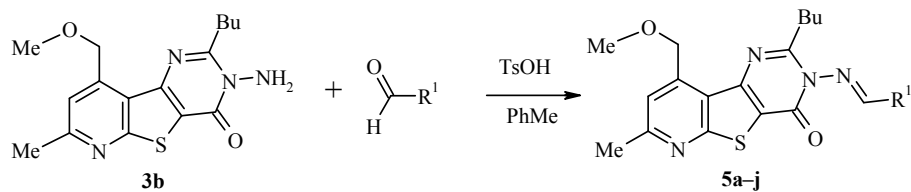
1	2	3	4	5	6	7
<b>5e</b>	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> S	<u>62.79</u> 62.87	<u>5.77</u> 5.70	<u>14.70</u> 14.66	297–298	92
<b>5f</b>	C <sub>25</sub> H <sub>29</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> S	<u>64.73</u> 64.77	<u>6.27</u> 6.31	<u>15.18</u> 15.11	225–226	80
<b>5g</b>	C <sub>23</sub> H <sub>22</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>56.40</u> 56.44	<u>4.61</u> 4.53	<u>11.50</u> 11.45	229–230	90
<b>5h</b>	C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> BrN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>55.38</u> 55.31	<u>4.61</u> 4.64	<u>11.28</u> 11.22	179–180	91
<b>5i</b>	C <sub>23</sub> H <sub>23</sub> BrN <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>53.68</u> 53.60	<u>4.47</u> 4.50	<u>10.93</u> 10.87	216–217	89
<b>5j</b>	C <sub>24</sub> H <sub>23</sub> BrN <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	<u>53.00</u> 53.04	<u>4.33</u> 4.27	<u>10.35</u> 10.31	227–228	66
<b>6</b>	C <sub>20</sub> H <sub>24</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S	<u>57.74</u> 57.68	<u>5.83</u> 5.81	<u>13.38</u> 13.45	164–165	80
<b>7a</b>	C <sub>20</sub> H <sub>22</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>62.90</u> 62.81	<u>5.72</u> 5.80	<u>14.68</u> 14.65	243–244	75
<b>7b</b>	C <sub>22</sub> H <sub>18</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S	<u>65.72</u> 65.65	<u>4.48</u> 4.51	<u>14.00</u> 13.92	261–262	86
<b>7c</b>	C <sub>23</sub> H <sub>20</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S	<u>63.93</u> 63.87	<u>4.61</u> 4.66	<u>13.02</u> 12.95	262–263	75
<b>8</b>	C <sub>17</sub> H <sub>19</sub> N <sub>5</sub> OS	<u>59.87</u> 59.80	<u>5.55</u> 5.61	<u>20.44</u> 20.51	264–265	57
<b>9a</b>	C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	<u>64.00</u> 64.08	<u>4.51</u> 4.48	<u>12.49</u> 12.45	>300	53
<b>9b</b>	C <sub>19</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S	<u>62.20</u> 62.11	<u>4.63</u> 4.66	<u>11.53</u> 11.44	>300	62
<b>9c</b>	C <sub>16</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S	<u>60.59</u> 60.54	<u>5.98</u> 6.03	<u>13.20</u> 13.24	270–271	50
<b>10a</b>	C <sub>14</sub> H <sub>17</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	<u>64.80</u> 64.85	<u>6.67</u> 6.61	<u>16.27</u> 16.20	199–200	25
<b>10b</b>	C <sub>16</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	<u>66.82</u> 66.88	<u>7.42</u> 7.37	<u>14.59</u> 14.62	209–210	52
<b>10c</b>	C <sub>19</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	<u>67.70</u> 67.64	<u>5.62</u> 5.68	<u>12.39</u> 12.45	235–236	62
<b>10d</b>	C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	<u>67.13</u> 67.07	<u>5.60</u> 5.63	<u>17.45</u> 17.38	128–129	68

гидразида в области 1650 см<sup>-1</sup>. Особенностью ЯМР <sup>1</sup>H спектров соединения **4** является наличие двух уширенных синглетных сигналов интенсивностью по 2H, принадлежащих к протонам аминогруппы (6.98) и гидразидной группы (9.82 м. д.).

Изучение реакционной способности синтезированных нами соединений **3** заключалось в исследовании взаимодействия их с альдегидами, уксусным ангидридом, 2,5-диметокситетрагидрофураном, формамидом и никелем Ренея.

В качестве объекта исследования реакции образования 3-[(*E*)-1-арилметилиденамино]-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-онов **5a–j** было выбрано соединение **3b** в связи с его наилучшей растворимостью

Схема 2



**5 a**  $\text{R}^1 = 4\text{-MeC}_6\text{H}_4$ , **b**  $\text{R}^1 = 4\text{-MeOC}_6\text{H}_4$ , **c**  $\text{R}^1 = 4\text{-EtOC}_6\text{H}_4$ , **d**  $\text{R}^1 = 4\text{-O}_2\text{NC}_6\text{H}_4$ ,  
**e**  $\text{R}^1 = 4\text{-AcNHC}_6\text{H}_4$ , **f**  $\text{R}^1 = 4\text{-Me}_2\text{NC}_6\text{H}_4$ , **g**  $\text{R}^1 = 3,4\text{-Cl}_2\text{C}_6\text{H}_3$ , **h**  $\text{R}^1 = 4\text{-BrC}_6\text{H}_4$ ,

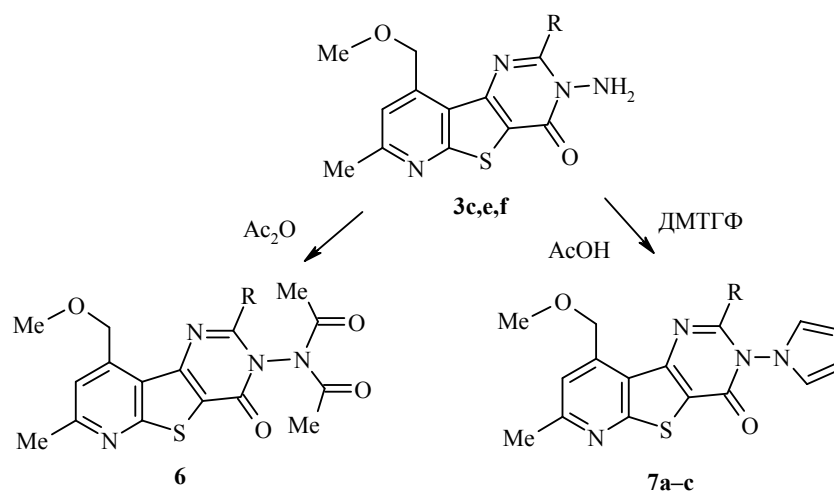
**i**  $\text{R}^1 = 2\text{-HO-5-BrC}_6\text{H}_3$ , **j**  $\text{R}^1 =$

в толуоле по сравнению с другими синтезированными нами соединениями этого ряда. Соединения **5** были получены при кипячении исходного 3-аминопиридинона **3b** с ароматическими альдегидами в толуоле в присутствии *n*-толуолсульфокислоты с азеотропной отгонкой воды. Выделенные соединения **5** представляют собой устойчивые кристаллические вещества. Выход продуктов реакции составляет 66–98%.

Особенностью ИК спектров соединений **5a–j** является отсутствие полос валентных колебаний  $\nu\text{N-H}$  экзоциклической аминогруппы (табл. 2). Строение синтезированных соединений подтверждается и данными спектров ЯМР  $^1\text{H}$ : отсутствием сигнала протонов группы  $\text{N-NH}_2$  в области 8.64–10.90 м. д., наличием синглетного сигнала метинового протона группы  $\text{CH=N}$  в области 8.64–9.27 м. д. Протоны ароматических колец и заместителей в них резонируют в характерных для них областях спектра.

При кипячении 3-амино-2-изобутилпиродотиенопиримидина **3c** в уксусном ангидриде в течение 6 ч образуются бесцветные кристаллы диацилпроизводного **6** с выходом 80%.

Схема 3



**3c, 6, 7a**  $\text{R} = i\text{-Bu}$ , **3e, 7b**  $\text{R} = \text{Ph}$ , **3f, 7c**  $\text{R} = 4\text{-MeOC}_6\text{H}_4$ ,  
 ДМТГФ-диметокситетрагидрофуран

Удачной оказалась и попытка синтеза *N*-замещенных пирролов **7a–c**, который был осуществлен по описанной методике [9], путем кипячения

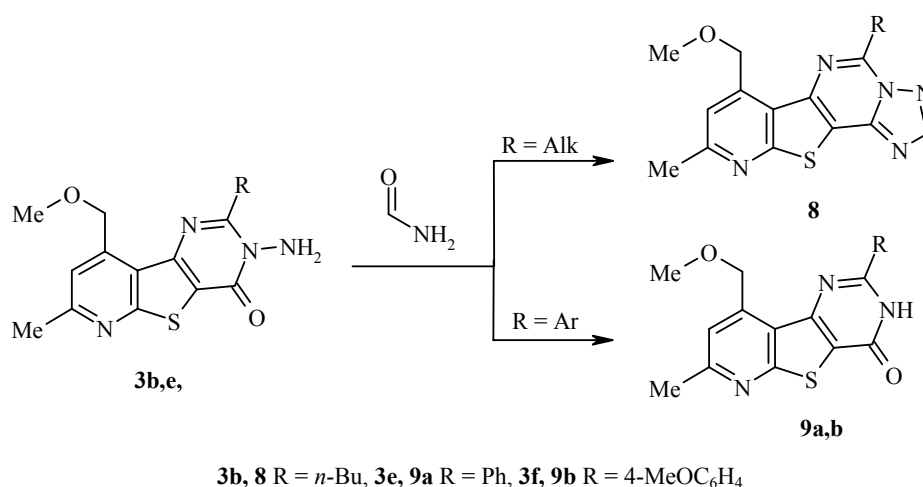
3-аминопиримидинонов **3c,e,f** с 2,5-диметокситетрагидрофураном в ледяной уксусной кислоте. Продолжительность реакции 1–2.5 ч. Соединения **7** получены с выходом 75–86%.

Строение соединений **6** и **7a–c** согласуется с данными ИК и ЯМР  $^1\text{H}$  спектров (табл. 2).

Неоднозначно проходит реакция 3-аминопиридотиенопиримидионов **3** с формамидом. Так, при кипячении пиримидинона **3b**, содержащего в качестве заместителя в положении 2 *n*-бутильный фрагмент, в формамиде образуется пиридо[3',2':4,5]тиено[2,3-*e*][1,2,4]триазоло[1,5-*c*]пиримидин **8** (выход 57%). В то же время, взаимодействие с формамидом трициклических пиримидинонов **3e,f**, имеющих ароматические заместители, сопровождается расщеплением связи N–NH<sub>2</sub>, что приводит к образованию незамещенных в положении 3 пиримидинонов **9a,b**, представляющих собой бесцветные кристаллические вещества с температурой плавления выше 300 °С.

Молекулярные массы соединений **8** и **9a,b**, определенные масс-спектрометрически, совпадают с вычисленными. В спектрах ЯМР  $^1\text{H}$  тетрациклического соединения **8** и пиримидинонов **9a,b** отсутствует сигнал протонов группы NH<sub>2</sub> исходных 3-аминопиримидинонов **3b,e,f**. В спектре продукта **8** синглетный сигнал интенсивностью 1H в области 5.94 м. д. отнесен к СН-фрагменту триазольного цикла (табл. 2), а в спектрах соединений **9a,b** синглетный сигнал в области 12.97–13.04 м. д. – протону NH пиримидинона.

Схема 4



Для получения 4-(3-пиридил)-1,6-дигидро-6-пиримидинонов **10** была исследована реакция десульфуризации синтезированных дигидропиридотиенопиримидинонов **3** никелем Ренея. При попытке осуществления данной реакции по методике [10] нами был выделен продукт **9c** с выходом 50%.

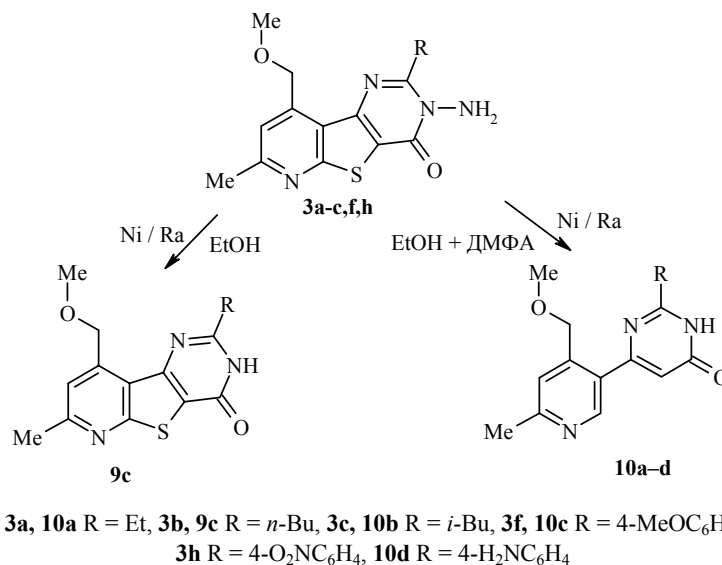
В спектре ЯМР  $^1\text{H}$  соединения **9c** имеется уширенный синглетный сигнал интенсивностью 1H в области 12.78 м. д., который отнесен к протону N–H пиримидинового цикла. В масс-спектре имеется пик моле-

кулярного иона с массой 317, что соответствует рассчитанной молекулярной массе.

Исходя из предположения, что соединение **9** является полупродуктом при образовании соединений **10**, варьируя условия проведения реакции и время, мы подобрали оптимальные условия, в которых можно получить пиридилдигидропиримидиноны **10a–d**. Реакцию восстановительной десульфуризации удалось осуществить при взаимодействии с 10-кратным избытком никеля Ренея, применив в качестве растворителя смесь этанола и ДМФА, поддерживая температуру реакционной смеси в интервале 100–110 °С.

При введении в реакцию с Ni/Ra 3-амино-2-(4-нитрофенил)-3,4-дигидропиридотиенопиримидинона **3h** помимо расщепления связи N–NH<sub>2</sub> и десульфуризации тиофенового цикла происходит, как мы и ожидали, восстановление нитрогруппы до аминогруппы с образованием 2-(4-аминофенил)-4-(3-пиридил)-1,6-дигидро-6-пиримидинона **10d**. Выход продуктов **10a–d** составляет 25–68%.

Схема 5



Структура соединений **10a–d** подтверждена совокупностью спектральных данных. В спектрах ЯМР <sup>1</sup>H имеются сигналы всех протонов, входящих в состав данных структур. В области 6.32–6.50 м. д. наблюдается синглетный сигнал протона пиримидинового цикла в положении 6, сигнал в области 8.50–8.60 м. д. отнесен к протону пиридинового кольца, незамещенного в положении 2, а уширенный пик в области 12.35–12.71 м. д. принадлежит фрагменту NH пиримидина. Масс-спектры данных соединений содержат пики молекулярных ионов с массами, равными рассчитанным молекулярным массам. В ИК спектре соединения **10d** в области 3325–3190 см<sup>-1</sup> имеются две полосы валентных колебаний аминогруппы.

Т а б л и ц а 2

#### Спектральные характеристики соединений 2–10

Соединение	ИК спектр, $\nu$ , $\text{см}^{-1}$		Спектр ЯМР $^1\text{H}$ , $\delta$ , м. д. ( $J$ , Гц)
	NH	C=O	
1	2	3	4
<b>2a</b>	3280	1710, 1680	1.00 (3H, т, $J = 7.2$ , $\text{NHCOCH}_2\text{CH}_3$ ); 1.16 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 1.30 (2H, к, $J = 7.2$ , $\text{NHCOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.62 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.40 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.30 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.87 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.40 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 9.66 (1H, уш. с, NH)
<b>2b</b>	3280	1720, 1665	0.94 (3H, т, $J = 6.7$ , $\text{NHCOC}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.29 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 1.40 (2H, м, $\text{NHCOC}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.65 (2H, м, $\text{NHCOCH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.38 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{NHCOCH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 2.62 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.40 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.29 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.89 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.40 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 9.73 (1H, уш. с, NH)
<b>2c</b>	3285	1700, 1665	1.00 (6H, д, $J = 6.1$ , $\text{COCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ); 1.30 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.14 (1H, м, $\text{COCH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ); 2.28 (2H, д, $J = 6.5$ , $\text{COCH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 2.62 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.40 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.29 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.87 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.40 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 9.68 (1H, уш. с, NH)
<b>2d</b>	3225	1710, 1670	1.15 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.64 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.34 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.23 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.85 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 6.76 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-4}}$ ); 7.37 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-3}}$ ); 7.44 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.00 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-5}}$ ); 9.73 (1H, уш. с, NH)
<b>2e</b>	3210	1720, 1680	1.15 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.63 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.34 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.26 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.87 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.43 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.59 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-4}}$ ); 7.65 (2H, д, $^3J = 7.4$ , $^4J = 1.0$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 8.03 (2H, д, $J = 7.4$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 10.37 (1H, уш. с, NH)
<b>2f</b>	3320	1680, 1640	1.19 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.54 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.30 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.02 (3H, с, $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$ ); 4.25 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.90 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.13 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-4}}$ ); 7.25 (1H, д, $J = 8.3$ , $\text{H}_{\text{Ar-3}}$ ); 7.42 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.58 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-5}}$ ); 7.92 (1H, д, $J = 7.8$ , $\text{H}_{\text{Ar-6}}$ ); 10.17 (1H, уш. с, NH)
<b>2g</b>	3240	1715, 1655	1.16 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.64 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.32 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 3.88 (3H, с, $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$ ); 4.25 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.86 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.12 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 7.43 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.02 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 10.20 (1H, уш. с, NH)
<b>2h</b>	3160	1700, 1650	1.29 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.66 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.42 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.84 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 5.07 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.48 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.83 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-4}}$ ); 7.98 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-5}}$ ); 8.11 (2H, м, $\text{H}_{\text{Ar-3,6}}$ ); 10.72 (1H, уш. с, NH)
<b>2i</b>	3160	1685, 1640	1.15 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.62 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.30 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.23 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.82 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.42 (1H, с, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.22 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.42 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 10.68 (1H, уш. с, NH)
<b>2j</b>	3140	1725, 1640	1.27 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 2.50 (3H, с, $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$ ); 2.64 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.35 (3H, с, $\text{OCH}_3$ ); 4.32 (2H, к, $J = 7.1$ , $\text{COOCH}_2\text{CH}_3$ ); 4.97 (2H, с, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.36–7.45 (4H, м, $\text{H}_{\text{Py}}$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,4,5}}$ ); 7.79 (1H, д, $J = 7.4$ , $\text{H}_{\text{Ar-6}}$ ); 10.18 (1H, уш. с, NH)

Продолжение таблицы 2

1	2	3	4
<b>3a</b>	3295,	1660	1.35 (3H, т, $J = 7.4$ , $\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 2.40 (3H, с, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.06 (2H,



	3210		$\kappa$ , $J = 7.4$ , $\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 3.50 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.25 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.66 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.40 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ )
<b>3b</b>	3320, 3215	1665	0.98 (3H, т, $J = 6.7$ , $\text{C}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.48 (2H, м, $\text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.84 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.64 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.03 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.49 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.21 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.93 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.46 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ )
<b>3c</b>	3315, 3225	1655	1.06 (6H, д, $J = 6.1$ , $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ); 2.40 (1H, м, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ ); 2.65 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 2.92 (2H, д, $J = 6.5$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.49 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.22 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.94 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.40 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ )
<b>3d</b>	3325, 3215	1660	2.67 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.57 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.31 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 6.02 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 6.69 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-4}}$ ); 7.45 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.80 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-3}}$ ); 7.87 (1H, м, $\text{H}_{\text{Fur-5}}$ )
<b>3e</b>	3325, 3230	1670	2.67 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.44 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.20 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.90 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.48 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.55 (3H, м, $\text{H}_{\text{Ar-3,4,5}}$ ); 7.96 (2H, д, $J = 7.4$ , $\text{H}_{\text{Ph-2,6}}$ )
<b>3f</b>	3265, 3185	1665	2.66 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.46 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 3.82 (3H, c, $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$ ); 5.23 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.94 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.19 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 7.50 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.02 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ )
<b>3g</b>	3305, 3170	1670	2.68 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.40 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.09 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.85 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.52 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.85–8.01 (3H, м, $\text{H}_{\text{Ar-3,4,5}}$ ); 8.27 (1H, д, $J = 8.0$ , $\text{H}_{\text{Ar-6}}$ )
<b>3h</b>	3285 3190	1690	2.68 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.40 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.20 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 5.93 (2H, c, $\text{NH}_2$ ); 7.54 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.26 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.40 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ )
<b>4</b>	3405, 3370, 3315	1650 1590	2.58 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 3.39 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 3.93 (3H, c, $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$ ); 4.85 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 6.98 (2H, уш. c, $\text{NH}_2$ ); 7.09 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-4}}$ ); 7.18 (1H, д, $J = 8.4$ , $\text{H}_{\text{Ar-3}}$ ); 7.26 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.53 (1H, м, $\text{H}_{\text{Ar-5}}$ ); 7.79 (1H, д, $J = 7.8$ , $\text{H}_{\text{Ar-6}}$ ); 9.82 (2H, уш. c, $\text{NH-NH}$ )
<b>5a</b>	–	1670	0.94 (3H, т, $J = 6.7$ , $\text{C}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.45 (2H, м, $\text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.81 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.43 (3H, c, $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_3$ ); 2.68 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 2.90 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.52 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.25 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.42 (2H, д, $J = 7.9$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 7.53 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.87 (2H, д, $J = 7.9$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.92 (1H, c, $\text{N=CH}$ )
<b>5b</b>	–	1670	0.94 (3H, т, $J = 6.7$ , $\text{C}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.45 (2H, м, $\text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.81 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.66 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 2.89 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.51 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 3.88 (3H, c, $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_3$ ); 5.25 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.14 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 7.51 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.92 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.85 (1H, c, $\text{N=CH}$ )
<b>5c</b>	–	1670	0.93 (3H, д, $J = 6.1$ , $\text{C}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.37 (3H, т, $J = 7.1$ , $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ); 1.45 (2H, м, $\text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.80 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.65 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 2.89 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.50 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 4.16 (2H, $\kappa$ , $J = 7.1$ , $\text{C}_6\text{H}_4\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ); 5.25 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.11 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 7.49 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 7.90 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.84 (1H, c, $\text{N=CH}$ )
<b>5d</b>	–	1670	0.95 (3H, т, $J = 6.7$ , $\text{C}_3\text{H}_6\text{CH}_3$ ); 1.48 (2H, м, $\text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_2\text{CH}_3$ ); 1.81 (2H, м, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}_2\text{H}_5$ ); 2.67 (3H, c, $\text{CH}_3\text{-Py}$ ); 2.97 (2H, т, $J = 7.0$ , $\text{CH}_2\text{C}_3\text{H}_7$ ); 3.51 (3H, c, $\text{OCH}_3$ ); 5.25 (2H, c, $\text{CH}_2\text{O}$ ); 7.52 (1H, c, $\text{H}_{\text{Py}}$ ); 8.23 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-2,6}}$ ); 8.39 (2H, д, $J = 8.5$ , $\text{H}_{\text{Ar-3,5}}$ ); 9.27 (1H, c, $\text{N=CH}$ )

Продолжение таблицы 2

1	2	3	4
---	---	---	---

<b>5e</b>	3340	1670, 1610	0.93 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.41 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.78 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.08 (3H, с, $NHCOCH_3$ ); 2.63 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.86 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.48 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.21 (2H, с, $CH_2O$ ); 7.48 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.77 (2H, д, $J = 7.9$ , $H_{Ar-3,5}$ ); 7.88 (2H, д, $J = 7.9$ , $H_{Ar-2,6}$ ); 8.82 (1H, с, $N=CH$ ); 10.28 (1H, с, $NHCOCH_3$ )
<b>5f</b>		1670	0.95 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.44 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.80 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.66 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.87 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.06 (6H, с, $N(CH_3)_2$ ); 3.52 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.24 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.84 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-3,5}$ ); 7.49 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.75 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-2,6}$ ); 8.64 (1H, с, $N=CH$ )
<b>5g</b>	–	1660	0.94 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.44 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.80 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.63 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.92 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.49 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.23 (2H, с, $CH_2O$ ); 7.48 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.80 (1H, д, $J = 8.9$ , $H_{Ar-5}$ ); 7.91 (1H, д, $J = 8.9$ , $H_{Ar-6}$ ); 8.13 (1H, с, $H_{Ar-2}$ ); 9.08 (1H, с, $N=CH$ )
<b>5h</b>	–	1680	0.92 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.43 (2H, м, $(C_2H_4CH_2CH_3)$ ); 1.76 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.64 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.86 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.48 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.20 (2H, с, $CH_2O$ ); 7.48 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.78 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-2,6}$ ); 7.89 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-3,5}$ ); 8.99 (1H, с, $N=CH$ )
<b>5i</b>	–	1660	0.96 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.45 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.78 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.65 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.86 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.50 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.19 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.99 (1H, д, $J = 8.3$ , $H_{Ar-3}$ ); 7.48 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.61 (1H, д, $J = 8.3$ , $H_{Ar-4}$ ); 8.06 (1H, с, $H_{Ar-6}$ ); 9.11 (1H, с, $N=CH$ ); 10.90 (1H, с, $OH$ )
<b>5j</b>	–	1665	0.93 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.42 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.78 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.62 (3H, с, $CH_3$ -Py); 2.87 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.48 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.17 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.20 (2H, с, $OCH_2O$ ); 7.42 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.45 (1H, с, $H_{Ph-6}$ ); 7.62 (1H, с, $H_{Ph-3}$ ); 9.15 (1H, с, $N=CH$ )
<b>6</b>	–	1725, 1700, 1670	1.07 (6H, д, $J = 6.1$ , $CH_2CH(CH_3)_2$ ); 2.41 (7H, м, $CH_2CH(CH_3)_2$ , $N(COCH_3)_2$ ); 2.63 (2H, д, $J = 6.5$ , $CH_2C_3H_7$ ); 2.69 (3H, с, $CH_3$ -Py); 3.50 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.26 (2H, с, $CH_2O$ ); 7.57 (1H, с, $H_{Py}$ )
<b>7a</b>	–	1675	0.98 (6H, д, $J = 6.1$ , $CH_2CH(CH_3)_2$ ); 2.31 (3H, м, $CH_2CH(CH_3)_2$ ); 2.69 (3H, с, $CH_3$ -Py); 3.50 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.25 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.28 (2H, м, $H_{\beta}$ пиррола); 7.10 (1H, с, $H_{Py}$ ); 7.55 (2H, м, $H_{\alpha}$ пиррола)
<b>7b</b>	–	1690	2.71 (3H, с, $CH_3$ -Py); 3.33 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.20 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.02 (2H, м, $H_{\beta}$ пиррола); 7.03 (2H, м, $H_{\alpha}$ пиррола); 7.36 (2H, м, $H_{Ar-3,5}$ ); 7.44 (1H, м, $H_{Ar-4}$ ); 7.58 (2H, д, $J = 7.4$ , $H_{Ar-2,6}$ ); 7.60 (1H, с, $H_{Py}$ )
<b>7c</b>	–	1690	2.70 (3H, с, $CH_3$ -Py); 3.46 (3H, с, $OCH_3$ ); 3.78 (3H, с, $C_6H_4OCH_3$ ); 5.24 (2H, с, $CH_2O$ ); 6.10 (2H, м, $H_{\beta}$ пиррола); 6.90 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-3,5}$ ); 7.03 (2H, м, $H_{\alpha}$ пиррола); 7.52 (2H, д, $J = 8.5$ , $H_{Ar-2,6}$ ); 7.57 (1H, с, $H_{Py}$ )
<b>8</b>	–	–	0.96 (3H, т, $J = 6.7$ , $C_3H_6CH_3$ ); 1.43 (2H, м, $C_2H_4CH_2CH_3$ ); 1.79 (2H, м, $CH_2CH_2C_2H_5$ ); 2.63 (3H, с, $CH_3$ -Py); 3.00 (2H, т, $J = 7.0$ , $CH_2C_3H_7$ ); 3.48 (3H, с, $OCH_3$ ); 5.19 (2H, с, $CH_2O$ ); 5.94 (1H, с, $N=CH$ ); 7.45 (1H, с, $H_{Py}$ )

Окончание таблицы 2

1	2	3	4
9a	–	1620	2.67 (3H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 3.51 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 5.33 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 7.51 (1H, c, H <sub>Py</sub> ); 7.60 (3H, м, H <sub>Ar</sub> -3,4,5); 8.23 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -2,6); 13.04 (1H, уш. с, NH)
9b	–	1625	2.68 (3H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 3.55 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 3.89 (3H, c, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub> ); 5.36 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 7.15 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -3,5); 7.52 (1H, c, H <sub>Py</sub> ); 8.24 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -2,6); 12.97 (1H, уш. с, NH)
9c	–	1690	0.95 (3H, т, J = 6.7, C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.40 (2H, м, C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 1.79 (2H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>7</sub> ); 2.65 (3H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 2.74 (2H, т, J = 7.0, CH <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ); 3.50 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 5.22 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 7.49 (1H, c, H <sub>Py</sub> ); 12.78 (1H, уш. с, NH)
10a	–	1665	1.21 (3H, т, J = 7.4, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 2.50 (1H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 2.61 (2H, кв, J = 7.4, CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ); 3.32 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 4.63 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 6.40 (1H, c, H-6 пиримидинона); 7.40 (1H, c, H <sub>Py</sub> -5); 8.50 (1H, c, H <sub>Py</sub> -2); 12.51 (1H, уш. с, NH)
10b	–	1660	0.95 (6H, м, CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ); 2.17 (1H, м, CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>6</sub> ); 2.48 (2H, м, CH <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ); 2.51 (1H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 3.32 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 4.10 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 6.39 (1H, c, H-6 пиримидинона); 7.40 (1H, c, H <sub>Py</sub> -5); 8.50 (1H, c, H <sub>Py</sub> -2); 12.57 (1H, уш. с, NH)
10c	–	1670	2.55 (1H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 3.30 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 3.85 (3H, c, C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> OCH <sub>3</sub> ); 4.70 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 6.50 (1H, c, H-6 пиримидинона); 7.10 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -3,5); 7.44 (1H, c, H <sub>Py</sub> -5); 8.19 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -2,6); 8.60 (1H, c, H <sub>Py</sub> -2); 12.71 (1H, уш. с, NH)
10d	3325, 3190	1630	2.53 (1H, c, CH <sub>3</sub> -Py); 3.31 (3H, c, OCH <sub>3</sub> ); 4.69 (2H, c, CH <sub>2</sub> O); 5.95 (2H, c, NH <sub>2</sub> ); 6.32 (1H, c, H-6 пиримидинона); 6.62 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -3,5); 7.41 (1H, c, H <sub>Py</sub> -5); 7.92 (2H, д, J = 8.5, H <sub>Ar</sub> -2,6); 8.58 (1H, c, H <sub>Py</sub> -2); 12.35 (1H, уш. с, NH)

## ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

ИК спектры сняты на спектрофотометре Specord IR-75 при комнатной температуре в вазелиновом масле. Спектры ЯМР <sup>1</sup>H сняты на приборе Bruker DRX 500 (500 МГц) в DMSO-d<sub>6</sub>, внутренний стандарт TMS. Масс-спектры получены на приборе Varian CH-6 с прямым вводом вещества в ионизационную камеру при температуре 50–180 °С и энергии ионизации электронов 70 эВ. Элементный анализ синтезированных соединений выполнен на анализаторе Carlo-Erba модели 1106.

**Этиловый эфир 3-этилкарбоксамидо-6-метил-4-метоксиметилтиено[2,3-*b*]пиридин-2-карбоновой кислоты (2a).** К 5 г (17.8 ммоль) эфира **1** добавляют 50 мл толуола, нагревают до полного растворения и вносят 1.7 г (19.6 ммоль) хлорангирида пропионовой кислоты. Смесь кипятят в течение 1 ч. Растворитель упаривают почти досуха. Образовавшийся осадок отфильтровывают, промывают 3% раствором Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, водой до pH 7 и сушат на воздухе. Продукт перекристаллизовывают из *i*-PrOH.

**Соединения 2b–j** получают аналогично. Окончание реакции в каждом конкретном случае контролируют методом ТСХ (элюент ацетон–гексан, 1:1) по исчезновению пятна исходного соединения **1**.

**3-Амино-7-метил-9-метоксиметил-2-этил-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-он (3a).** К кипящему раствору 3 г (8.9 ммоль) амида **2a** в 30 мл этанола добавляют 2.1 мл (44.5 ммоль) гидразингидрата. После окончания реакции (1ч) реакционную смесь охлаждают до комнатной температуры. Выпавший осадок отделяют, промывают

водой, сушат на воздухе. Получают 1.71 г соединения **3a**. Фильтрат после отделения

осадка выливают в 150 мл воды, образовавшиеся кристаллы отфильтровывают, промывают водой и сушат. Фракции объединяют и перекристаллизовывают из смеси 2-пропанол–ДМФА (объемное соотношение растворителей 10 : 3).

**3-Амино-3,4-дигидропиридотиенопиримидиноны 3b–h** получают аналогично с той лишь разницей, что в случае соединений **3b,c** в качестве растворителя используют *i*-PrOH, а в случае соединения **3f** – бутанол. Окончание реакции определяют методом ТСХ (элюент толуол–этанол, 10 : 3), контролируя расход соединения **2a**.

**N<sup>2</sup>-(2-Метоксибензил)-3-амино-6-метил-4-метоксиметилтиено[2,3-*b*]пиридин-2-карбогидразид (4)** получают аналогично соединениям **3**.

**2-Бутил-7-метил-9-метоксиметил-3[(*E*)-1-(4-метилфенил)метиленамино]-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-он (5a)**. К раствору 1 г (3.0 ммоль) 3-аминопиримидинона **3b** в 25 мл толуола добавляют 0.35 мл (3.0 ммоль) 4-метилбензальдегида и несколько кристалликов *n*-толуолсульфокислоты. Реакционную смесь кипятят в течение 7 ч (контроль методом ТСХ, элюент толуол–этанол, 20 : 3). После охлаждения до комнатной температуры из раствора выпадают бесцветные кристаллы. Осадок отфильтровывают, промывают EtOH, сушат. Продукт перекристаллизовывают из смеси растворителей *i*-PrOH–ДМФА, взятых в равных объемах.

**Соединения 5b–j** получают аналогично. Продолжительность реакции 2–7.5 ч.

**N-Ацетил-N-(2-изобутил-7-метил-9-метоксиметил-4-оксо-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]-тиено[3,2-*d*]пиримидин-3-ил)ацетамид (6)**. Раствор 0.7 г (2.1 ммоль) соединения **3c** в 5 мл уксусного ангидрида кипятят в течение 6 ч. После охлаждения до комнатной температуры реакционную массу выливают в 50 мл холодной воды. Раствор экстрагируют этилацетатом трижды по 50 мл. Экстракт выдерживают над Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, отфильтровывают, растворитель упаривают. Образовавшиеся кристаллы перекристаллизовывают из *i*-PrOH.

**2-Изобутил-7-метил-9-метоксиметил-3-(1-пирролил)-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]-тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-он (7a)**. При перемешивании нагревают смесь 1 г (3.0 ммоль) 3-аминопиримидинона **3c** и 5 мл уксусной кислоты. К кипящему раствору добавляют 0.47 мл (3.6 ммоль) 2,5-диметокситетрагидрофурана. Реакционную массу кипятят в течение 2.5 ч, охлаждают и выливают в 100 мл ледяной воды. Образовавшийся осадок отделяют и промывают водой до нейтральной реакции промывных вод, сушат на воздухе. Продукт перекристаллизовывают из смеси *i*-PrOH–ДМФА (объемное соотношение растворителей 3 : 1).

**Соединения 7b,c** синтезируют аналогично. При синтезе пиррола **7b** объем уксусной кислоты на 1 г исходного амина **3e** составляет 30 мл. Для получения продукта **7c** в качестве растворителя используется смесь уксусная кислота – ДМФА (10 : 1).

**5-Бутил-9-метил-7-метоксиметилпиридо[3',2':4,5]тиено[2,3-*e*][1,2,4]триазоло[1,5-*c*]пиримидин (8)**. Смесь 0.8 г (2.4 ммоль) пиримидина **3b** и 10 мл формамида кипятят 4.5 ч. Охлаждают, выпавший осадок отфильтровывают, промывают водой, сушат. Продукт перекристаллизовывают из петролейного эфира (фракция 70–100 °С).

**Соединения 9a,b** получают аналогично, но перекристаллизовывают из 2-пропанола.

**2-Бутил-7-метил-9-метоксиметил-3,4-дигидропиридо[3',2':4,5]тиено[3,2-*d*]пиримидин-4-он (9c)**. К кипящему раствору 0.5 г (1.5 ммоль) 3-аминопиримидина **3a** в 30 мл EtOH при интенсивном перемешивании в течение 2 ч малыми порциями вносят суспензию никеля Ренея в этаноле. Смесь кипятят в течение 11 ч (контроль методом ТСХ, элюент толуол–этанол, 20 : 3). Отделяют Ni/Ra. Охлаждают до комнатной температуры, выпавшие бесцветные кристаллы отделяют, промывают водой и сушат на воздухе. Продукт перекристаллизовывают из этанола.

**4-(6-Метил-4-метоксиметил-3-пиридил)-2-(4-метоксифенил)-1,6-дигидропиримидин-6-он (10c)**. Растворяют (0.7 г, 1.8 ммоль) исходного пиридотиенопиримидинона **3f** при нагревании в 30 мл смеси EtOH–ДМФА при объемном соотношении растворителей 1 : 1. В кипящий раствор вносят 10 г суспензии никеля Ренея в смеси растворителей EtOH–ДМФА в том же соотношении. Реакционную массу кипятят 10.5 ч, охлаждают, отделяют Ni/Ra и упаривают растворитель до 1/5 от исходного объема. Выпавший в виде бесцветных кристаллов осадок отфильтровывают и промывают водой. Фильтрат выливают в воду. Образовавшийся осадок отделяют, объединяют с первой фракцией и сушат на воздухе. Продукт перекристаллизовывают из 2-пропанола.

**Соединения 10a,b,d** синтезируют аналогично.

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. E. Bousquet, G. Romeo, F. Guerrero, *Farmaco*, **40**, 869 (1985).
2. C. G. Dave, P. R. Shah, A. B. Shah, K. C. Dave, V. J. Patel, *J. Chem. Soc.*, **66**, 48 (1989).
3. A. E. Abdel-Rahman, E. A. Bakhite, E. A. Al-Taifi, *J. Chin. Chem. Soc.*, **49**, 223 (2002).
4. В. И. Шведов, Т. П. Сычева, Т. В. Сакович, *XTC*, 1336 (1979). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **15**, 1074 (1979)].
5. А. М. Шестопалов, Ю. А. Шаранин, *ЖОрХ*, **9**, 1991 (1984).
6. M. Z. A. Badr, S. A. Mahgoub, F. F. Abdel-Latif, A. A. A. Abd El-Hafez, *Phosphorus, Sulfur, Silicon, Relat. Elem.*, **55**, 175 (1991).
7. С. Н. Сиракянц, Е. Г. Пароникян, А. С. Норовян, в кн. *Химия и биологическая активность кислород- и серусодержащих гетероциклов*, Тр. Второй Международной конференции, под ред. В. Г. Карцева, Москва, IBS PRESS, 2003, т 1, с. 398.
8. Е. А. Кайгородова, Л. Д. Конюшкин, М. Е. Ниязымбетов, С. Н. Квак, В. Н. Заплишний, В. П. Литвинов, *Изв. АН, Сер. хим.*, 2215 (1994).
9. Е. А. Кайгородова, А. А. Осипова, Л. Д. Конюшкин, Г. Д. Крапивин, *Изв. АН, Сер. хим.*, 817 (2004).
10. А. В. Кадушкин, Н. П. Соловьева, В. Г. Граник, *Хим.-фарм. журн.*, **26**, 40 (1993).

Кубанский государственный технологический  
университет, Краснодар 350072, Россия  
e-mail: kosten\_kate@mail.ru

Поступило 02.10.2006

<sup>a</sup>Кубанский государственный аграрный  
университет, Краснодар 350044, Россия  
e-mail: e\_kaigorodova@mail.ru

<sup>b</sup>Институт органической химии  
им. Н. Д. Зелинского РАН, Москва 119992  
e-mail: LeonidK@chemical-block.com

---