

СИНТЕЗ И АЛКИЛИРОВАНИЕ 4-АРИЛ-4,5-ДИЭТОКСИКАРБОНИЛ- 3,4-ДИГИДРОПИРИМИДИН-2(1H)-ОНОВ И ИХ АЗОЛОАЗИНОВЫХ АНАЛОГОВ

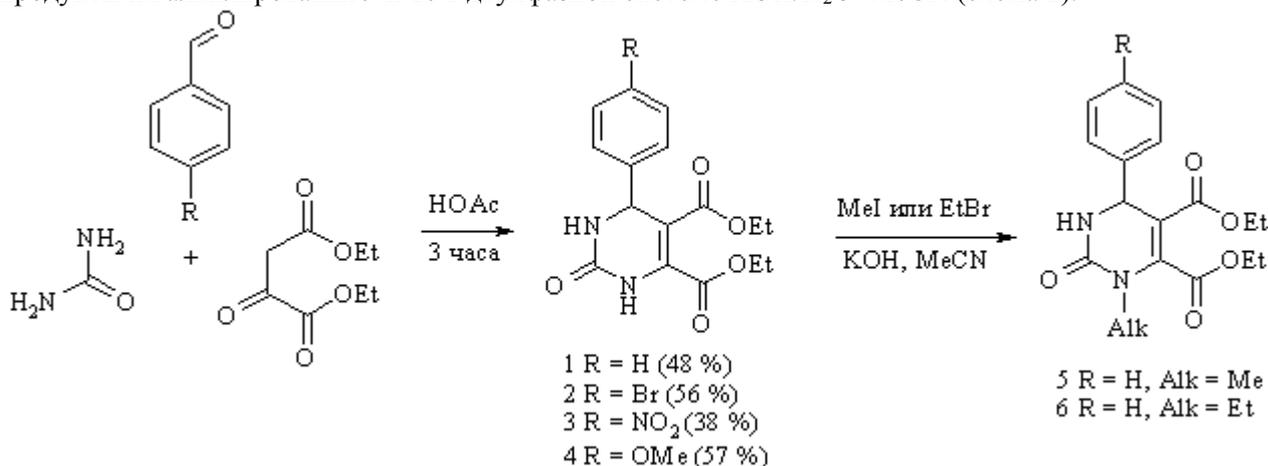
*Орлов В.Д., Ал-Огаили Муатаз, Колосов М.А., Кулык О.Г.
Харьков, Украина*

В течение весьма длительного периода производные 3,4-дигидропиримидин-2(1H)-она (соединения Биджинелли), а также их гетероаннелированные аналоги являются объектами интенсивных исследований в связи с разнообразной биологической активностью, проявляемой этими соединениями. Кроме того, указанные вещества – перспективные объекты для получения новых функциональных производных, что объясняется их относительной дешевизной, синтетической доступностью и высокой вариабельностью.

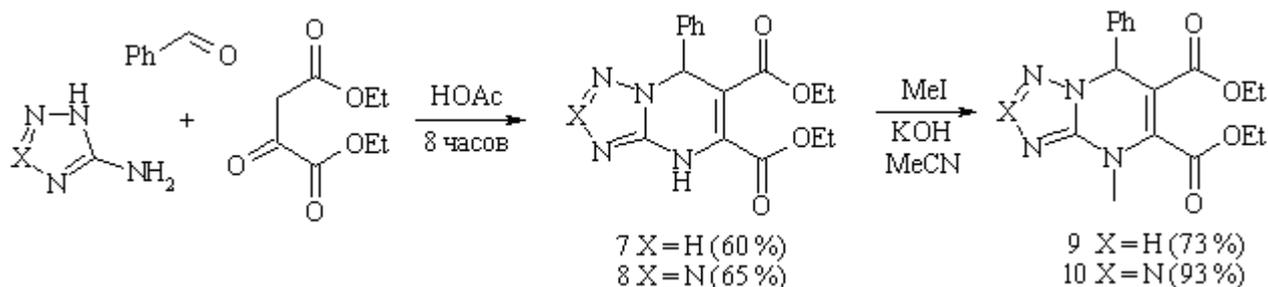
Целью настоящей работы стал синтез 4-арил-4,5-диэтоксикарбонил-3,4-дигидропиримидин-2(1H)-онов типа **1–4** (схема 1) и их азолазиновых аналогов с использованием предварительно полученного щавелевоуксусного эфира в качестве β-дикарбонильной составляющей, а также изучение их поведения в условиях реакции алкилирования.

Таким образом, эффективным способом получения 4-арил-4,5-диэтоксикарбонил-3,4-дигидропиримидин-2(1H)-онов является трёхкомпонентная реакция мочевины, ароматических альдегидов и щавелевоуксусного эфира в различных средах, а алкилирование этих соединений в системе KOH/H₂O–MeCN может быть успешно использовано для синтеза 1,3-*N,N*-диалкилзамещенных производных типа **5, 6** (схема 1).

В аналогичных условиях были получены гетероаннелированные производные **7 и 8**, а также продукты их алкилирования **9 и 10** в двухфазной системе KOH/H₂O–MeCN (схема 2).



**Схема 1 – Синтез 4-арил-4,5-диэтоксикарбонил-3,4-дигидропиримидин-
2(1H)-онов 1–4 и их 1-алкилзамещенных производных 5 и 6.**



**Схема 2 – Синтез диэтил-4,7-дигидро[1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин- и диэтил-4,7-
дигидротетразоло[1,5-а]пиримидин-5,6-дикарбоксилатов 7 и 8, и их 4-метилпроизводных 9 и 10.**

Индивидуальность всех веществ контролировалась с помощью ТСХ. Строение всех полученных соединений подтверждено данными ИК-, ¹H ЯМР и ¹³C ЯМР-спектроскопии, а также масс-спектрометрии.