

УДК 547.44 : 547.78 + 547.79 + 547.83 + 547.85

СИНТЕЗИ α -АЦИЛАМІНО- α -ГАЛОГЕНОКАРБОНІЛЬНИХ СПОЛУК ТА ГЕТЕРОЦИКЛІЗАЦІЇ НА ЇХ ОСНОВІ

А.Г.Баля, В.С.Броварець, **Б.С.Драч**

Інститут біоорганічної хімії та нафтохімії НАН України
02660, м. Київ, вул. Мурманська, 1. E-mail: brovarets@bpsci.kiev.ua

Ключові слова: заміщені α -ациламіно- α -галогенокарбонільні сполуки; гетероциклізації; циклоконденсації; азоли; азини; конденсовані гетероциклічні сполуки

В огляді узагальнені та проаналізовані літературні дані, які стосуються способів синтезу та гетероциклізацій α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук.

SYNTHESES AND HETEROCYCLIZATIONS OF α -ACYLAMINO- α -HALOGENO-CARBONYL COMPOUNDS

A.G.Balya, V.S.Brovarets, **B.S.Drach**

The literature data on methods of synthesis and heterocyclizations of α -acylamino- α -halogeno-carbonyl compounds are generalized and analyzed in the review.

СИНТЕЗИ α -АЦИЛАМИНО- α -ГАЛОГЕНОКАРБОНІЛЬНИХ СОЕДИНЕНІЙ И ГЕТЕРОЦИКЛИЗАЦИЙ НА ИХ ОСНОВЕ

А.Г.Баля, В.С.Броварець, **Б.С.Драч**

В обзоре обобщены и проанализированы литературные данные, касающиеся способов синтеза и гетероциклизаций α -ациламино- α -галогенокарбонильных соединений.

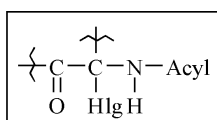
1. Загальна характеристика α -ациламіно- α -галогенокарбонільних реагентів

Основними представниками α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук з характерним фрагментом **A** (схема 1) є амідифенацільюючі засоби **A**¹, найближчі їх аналоги **A**² і споріднені з ними α -ациламіно- α -галогенокарбонілові кислоти та їх функціональні похідні **A**³.

Всі типи сполук з характерним фрагментом **A** містять надзвичайно рухливий атом хлору чи бро-

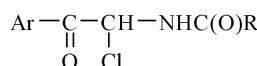
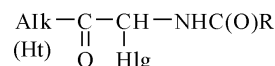
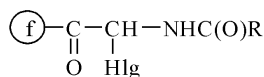
му, що обумовлено, з одного боку, впливом сусідньої карбонільної групи, а з другого — дією сусіднього ациламінного залишку, котрий обумовлює так званий α -ефект.

Хоча α -ациламіно- α -галогенокарбонільні реагенти, поза всякими сумнівами, ковалентні сполуки, але вклад іонних структур **B** і **B**, очевидно, досить значний, що і викликає унікальну рухливість хлору чи броду в цій електрофільній системі. Саме тому при обробці реагентів **A**¹, **A**², **A**³ *O*-, *S*-, *N*-, *P*- і *C*-нуклеофілами навіть у м'яких

**A**

Hlg = Cl, Br; Acyl = RC(O), AlkOC(O), R¹R²NC(O) та залишки кислот фосфору або сірки

Типи представників:

**A**¹**A**²**A**³

(f) = HO, AlkO, R¹R²N та ін.

Схема 1

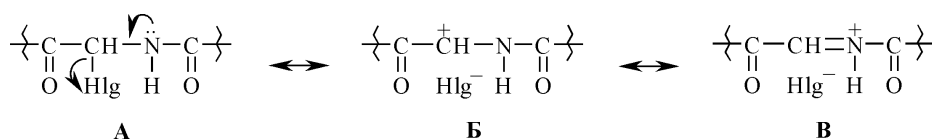


Схема 2

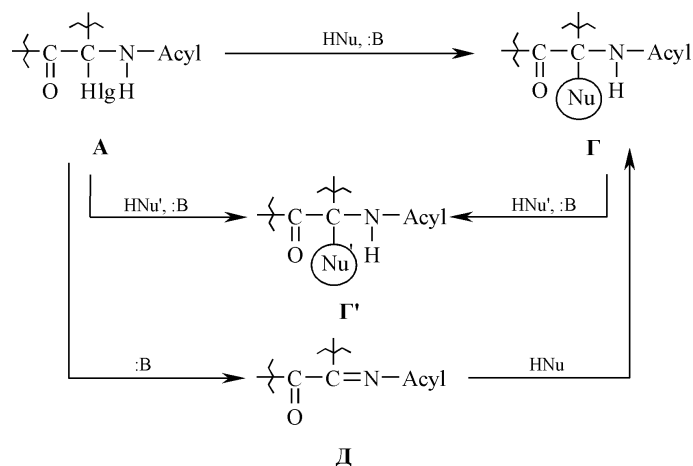


Схема 3

умовах часто утворюються відповідні ациклічні продукти заміщення рухливого атома галогену на відповідні залишки нуклеofilів (схема 3) [1-7].

Перетворення $A \rightarrow \Gamma$ в ряді випадків не є результатом нуклеофильного заміщення біля електрофильного центра зв'язку $C-Hlg$, а відбувається через проміжні продукти D — N -ациліміни α -дикарбонільних сполук, яким притаманна дуже висока електрофильність, що доведено експериментально [4-7].

Проте детальний розгляд процесу $A \rightarrow \Gamma$ виходить за рамки нашого огляду, який присвячений, в основному, висвітленню гетероциклізацій на основі α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук та їх похідних. Тому реакції структури A з нуклеофилами будуть розглядатися в подальшому тільки у тих випадках, коли споріднені структури Γ , Γ' придатні для циклізацій. Зрозуміло, що безпосередні циклоконденсації сполук типу A з двоцентровими нуклеофильними агентами будуть проаналізовані особливо детально. Однак перш ніж перейти до розгляду гетероциклізацій на основі різних типів α -ациламіно- α -галогенокарбонільних реагентів варто звернути увагу на способи їх синтезу, які лише частково були узагальнені в дисертаційних роботах І.Долгушиної [8] і О.Белюги [9]. Значна кількість статей з цього приводу все ж таки залишалась розпорошеною в різних журналах, які систематично оброблялись до середини 2009 р.

2. Одержання α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук з продуктів приєднання амідів карбонових кислот до фенілглюксалу та його аналогів

У 1965 р. Д. Нарді вперше показав, що аміди карбонових кислот легко приєднуються до фенілглюксалу [10]. В подальшому виявилось, що одержані продукти приєднання легко перетворюються на відповідні α -ациламіно- α -хлороацетофе-

нони за допомогою тіонілхлориду або пентахлориду фосфору (схема 4). Сферу підходу $3-1$ вдалося суттєво розширити і крім фенілглюксалу застосувати інші арилглюксали, *трет*-бутилглюксаль, а також деякі гетерилглюксали (перетворення $3-2$). Разом з тим заміщені глюксали легко взаємодіють не тільки з первинними амідами аліфатичних та ароматичних карбонових кислот, але й з амідами O -алкілвугільних кислот. Зрідка в таке перетворення вдалося ввести також N -метилацетамід [3], піролідон [14] та деякі β -лактами [17]. При цьому виходи проміжних напівамідів арилглюксалів суттєво залежать від температурного режиму проведення процесу і структури реагентів, а взаємодія їх з тіонілхлоридом завжди відбувається у м'яких умовах і дає з високим виходом амідофенацилюючі засоби. Загалом майже всі вони досить доступні, бо синтези необхідних арил- та гетерилглюксалів вдається здійснити у тих же умовах, що знайдені в процесі розробки зручного і добре опрацьованого способу одержання фенілглюксало окисненням ацетофенону селенистою кислотою, який описаний у загальновідомому збірнику "Синтези органічних препаратів" [18].

В результаті перетворень $3-1$, $3-2$, $3-3$ α -ациламіно- α -хлороацетофенони та їх аналоги одержують у вигляді безбарвних кристалічних речовин, які можна додатково очистити переосадженням з концентрованих бензолних розчинів гексаном. Проте для отримання з них гетероциклічних сполук використовують, як правило, некрystalізовані амідофенацилюючі засоби. Оскільки вони легко гідролізуються навіть вологою повітря, необхідно застосовувати лише свіжовиготовлені зразки цих препаратів.

Первинні аміди приєднуються не лише до арилглюксалів, але й до глюксилової кислоти, естерів глюксилової кислоти та напівметилалу метилово-

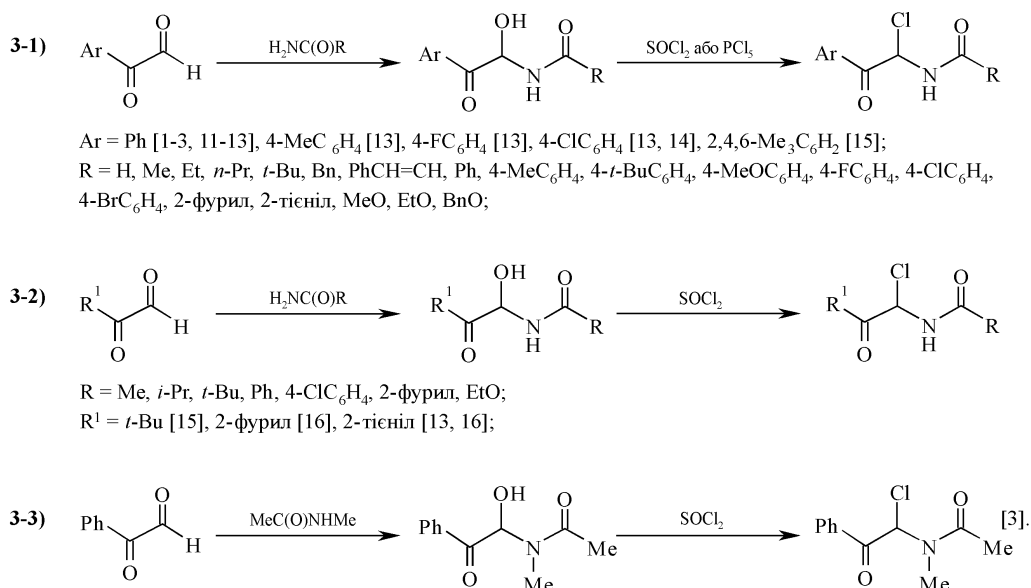


Схема 4

го естеру гліоксилової кислоти (схема 5). Одержані при цьому продукти приєднання перетворювались на відповідні α -ациламіно- α -галогенокарбонільні сполуки за допомогою тіонілхлориду, пентахлориду фосфору, ацетилхлориду [20], оксалілхлориду [23, 25] та триметилсилілброміду [29], які приводять до направленого заміщення напівамі-

дального гідроксилу на атом хлору або бромі (реакції 4-1, 4-2, 4-3). Крім того, заміщення подібної етилтіогрупи на хлор вдалося здійснити за допомогою сульфурилхлориду (перетворення 4-4). Нарешті деякі α -ациламіно- α -бромкарбонільні сполуки були одержані за участю триброміду фосфору або бору (перетворення 4-5).

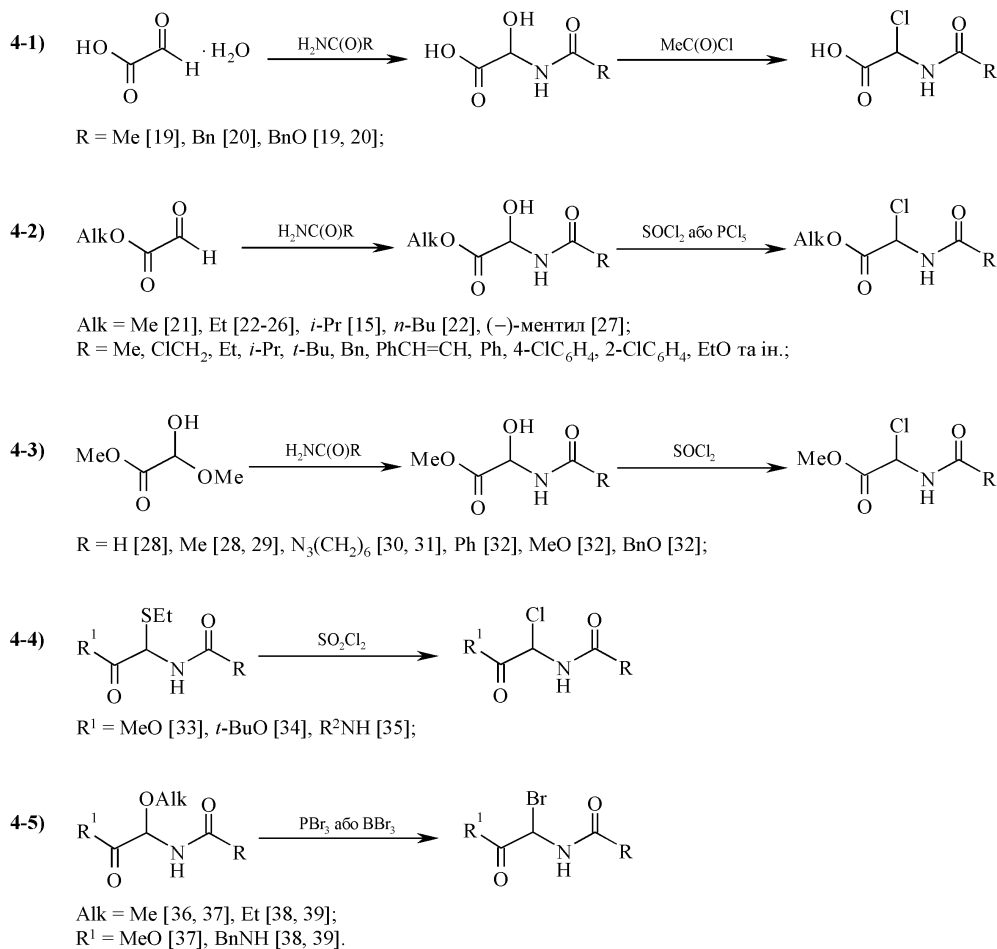


Схема 5

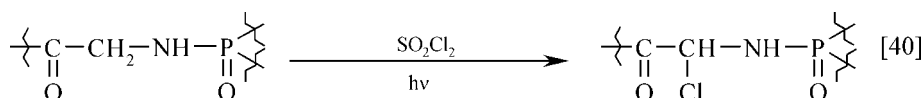


Схема 6

3. Галогенування α -ациламінокарбонільних сполук

У 1975 р. Б.Драч, І.Долгушина і А.Синиця описали перший приклад такого хлорування (схема 6).

Згодом виянилось, що фосфорильна група у цьому процесі не відіграє ніякої специфічної ролі, бо подібне хлорування за допомогою сульфурилхлориду вдалося здійснити і для деяких α -ациламінокарбонільних сполук (схема 7). Зрідка для цієї мети використовувався і *трет*-бутилгіпохлорит [42].

Проте більше препаративне значення мають реакції α -ациламінокарбонільних сполук з бромом та *N*-бромосукцинімідом, які представлені на схемі 8.

Найчастіше у такі реакції вводились *N*-ацильні похідні естерів гліцину. Бромовані похідні цих сполук часто не виділялись в індивідуальному стані, а відразу ж конденсувались з нуклеофілами, що використовувалось для модифікації похідних α -амінокислот і пептидів (приклади 6-4 та 6-5). Важливими проміжними продуктами є *N*-Вос-заміщені похідні естерів гліцину (підхід 6-3), які містять легковідхідну захисну групу біля атома азоту, яка витримує дію *N*-бромосукциніміду і обробку нуклеофільними агентами, а після цього знімається, що привело до синтезу значної кількості ациклічних модифікованих похідних α -амінокислот. Крім того, реагенти загальної формули

AlkOCOSCHBrNHCOR лише зрідка вдавалось застосувати для синтезу гетероциклічних сполук (розділ 5).

4. Гетероциклізації α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук без участі амідної групи

Реагенти з характерним угрупованням **A** можна розглядати, з одного боку, як функціоналізовані α -галогенокарбонільні сполуки, а з другого — як аналоги α -галогеноалкіламідів (схема 9).

У зв'язку з цим циклізації системи **A** можна розділити на два типи. До першого з них слід віднести загальновідомі циклізації за участю α -галогенокарбонільного фрагменту і при цьому група $\{-\text{NH}-\text{CO}-\}$ не зачіпається, що видно з матеріалу, представленого у цьому розділі. Другий тип циклоконденсацій на основі системи **A** пов'язаний з обов'язковою участю амідної групи в побудові гетероциклічного кільця (розділ 5).

Однією з найвідоміших гетероциклізацій на основі α -галогенокарбонільних сполук є реакція Ганча. Саме вона виявилась зручною для оцінки реакційної здатності амідфенацилюючих засобів загальної формули AgCOCHClNHAcyl , які легко циклізуються при дії, наприклад, тіоацетаміду, що було встановлено І.Долгушиною ще в 1973 р. [3, 8]. В подальшому циклоконденсації цих реагентів з різноманітними тіоамідними субстратами вивчали О.Смолий [71], Р.Виджак [72, 73], С.Сливчук [74],

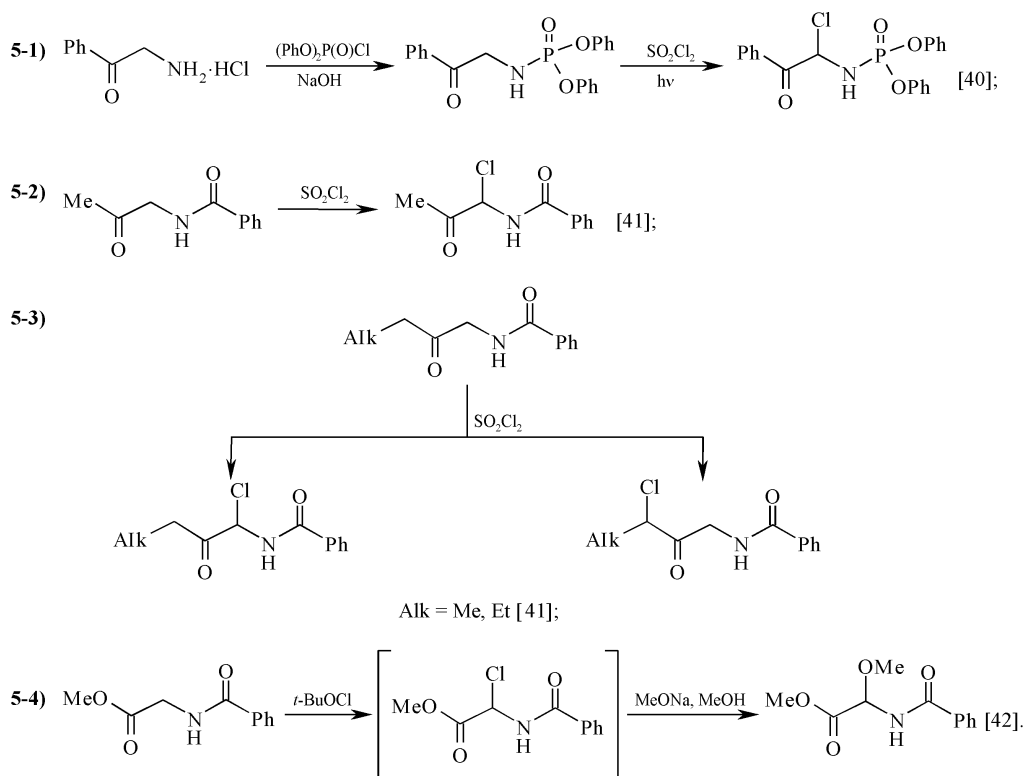
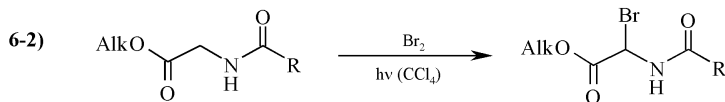
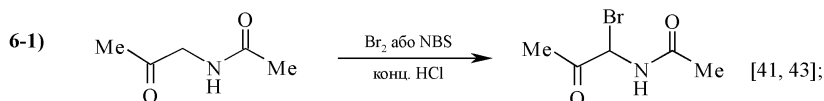
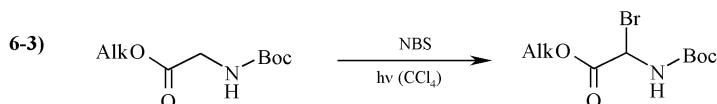


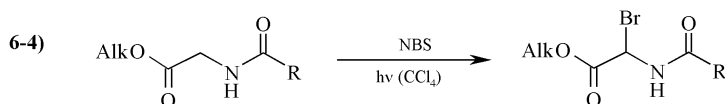
Схема 7



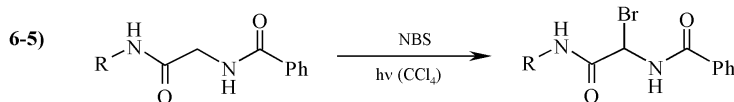
Alk = Me, Et, Cy, (+)-ментил, (-)-ментил;
R = Me, BrCH₂, F₃C, Ph, AlkO [44-47];



Alk = Me [48, 49], Et [50-52], CCl₃CH₂ [53], *t*-Bu [36, 54-56], (-)-8-фенілментил [57], Bn [58];
Boc = *t*-BuOC(O);



Alk = Me, Et, *t*-Bu, (+)-ментил, (-)-ментил;
R = Me [59-61], ClCH₂ [62], F₃C [60], Ph [47, 60, 63, 64], 4-FC₆H₄ [60], 2-ClC₆H₄ [65] та ін.;



R = MeOC(O)CH₂ [66], MeOC(O)CHCH(Me)₂ [67-70], MeOC(O)CHCH₂Ph [67, 69, 70].

Схема 8

О.Белюга [9], А.Баля [75-79] та інші дослідники. В результаті, як видно зі схеми 10, сфера застосування амідифенаціючих реагентів у циклізації Ганча виявилась досить широкою. В такі циклоконденсації вдалося ввести тіоацетамід, тіобензамід, тіосечовину, ціанотіоацетамід, дитіооксамід, дитіоамід маленової кислоти, дитіокарбамат амонію та інші сполуки, що містять тіокарбамоїльну групу.

Деякі з них виявилися цінними вихідними субстратами для подальших синтезів. Так, при обробці доступних 2-аміно-5-ациламіно-1,3-тіазолів бромоацетофеноном, *N*-(1-хлорофенацил)ацетамідом та хлороангідридом хлорооцтової кислоти розроблені зручні підходи для одержання нових похідних 2-аміноімідазо[2,1-*b*]тіазолу, які подано на схемі 11. Напрямок подібних реакцій добре ви-

вчений для похідних 2-аміно-1,3-тіазолу, які не містять ациламінінних залишків у положенні 5 тіазольного кільця. Як правило, алкілюючий *C-sp*³ центр α -галогенокарбонільного реагенту атакує атом азоту тіазольного кільця, а електрофільний *C-sp*² центр зв'язку C=O взаємодіє з екзоциклічною аміногрупою.

5-Ациламіно-2-меркапто-4-феніл-1,3-тіазоли, одержані при взаємодії амідифенаціючих реагентів та дитіокарбамату амонію (перетворення 7-10 на схемі 10), регіоселективно взаємодіють з метилйодидом, метилхлороацетатом, хлороацетонітрилом, ацетонілхлоридом і фенацилбромідом (схема 12). Внаслідок цього одержано відповідні *S*-заміщені похідні 5-ациламіно-2-меркапто-1,3-тіазолів [77].

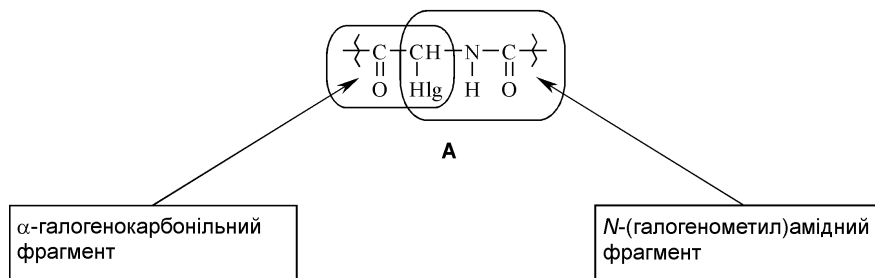


Схема 9

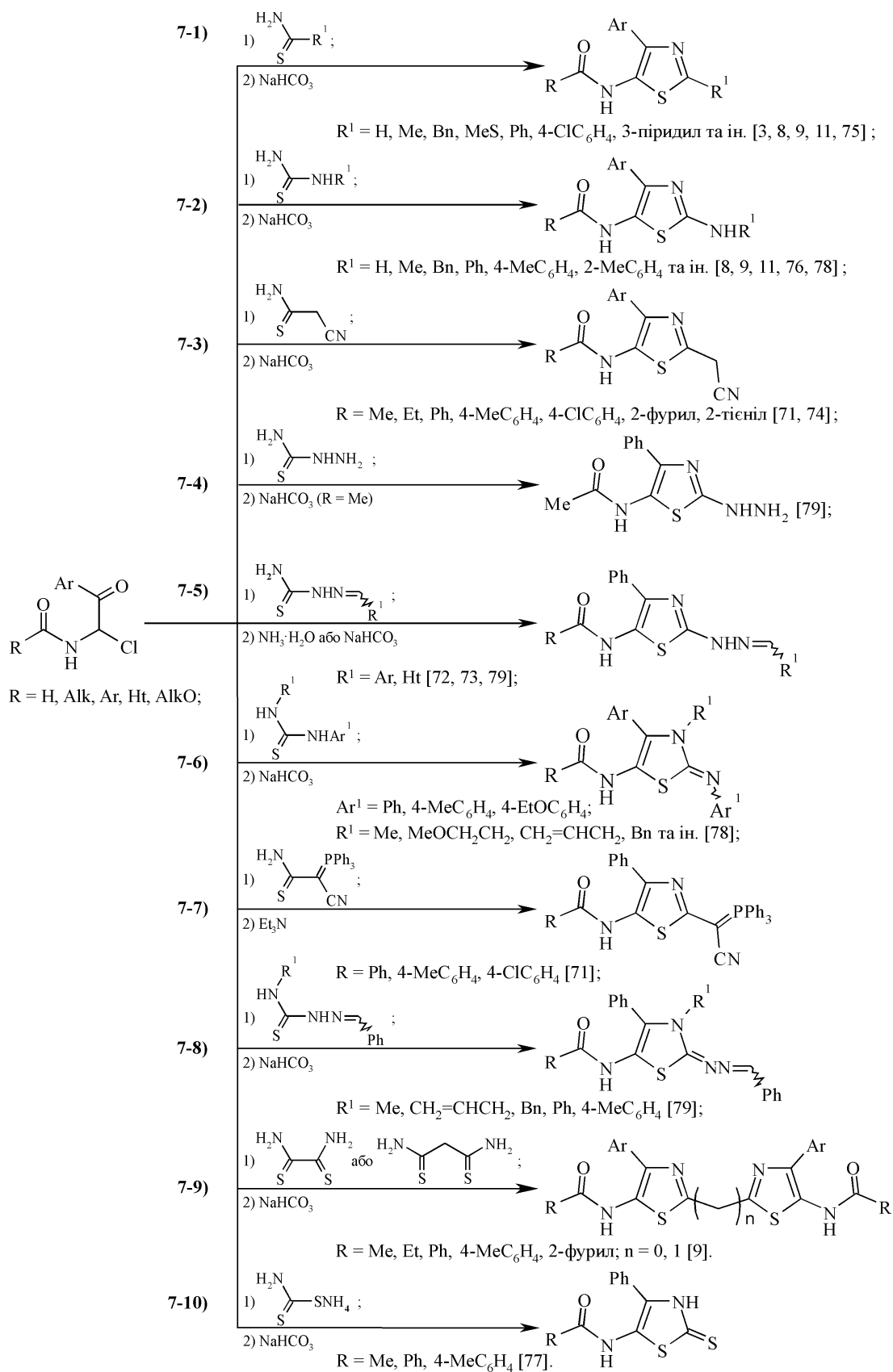


Схема 10

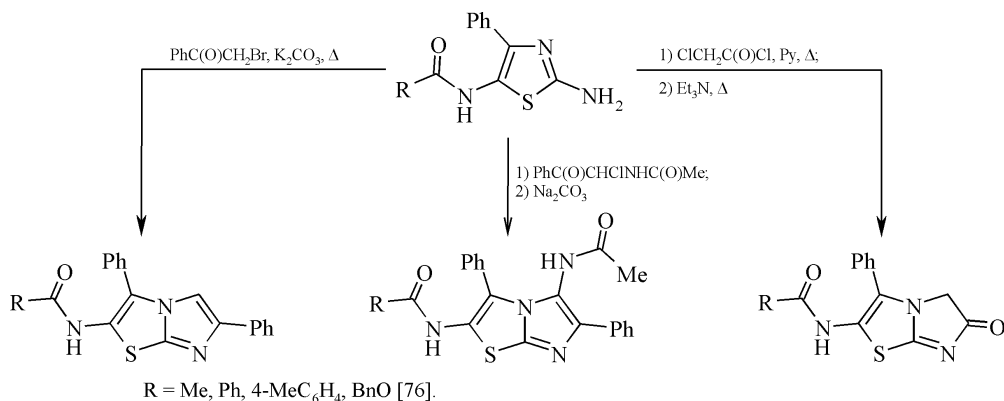


Схема 11

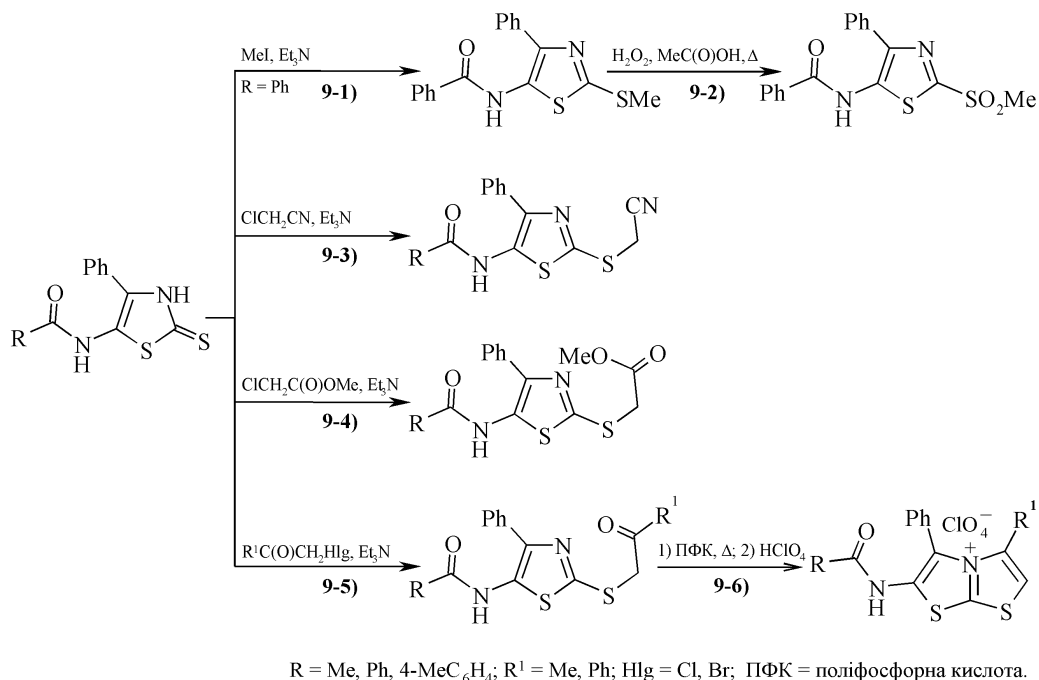


Схема 12

Особливий інтерес викликає циклоконденсація 9-6, яка відбувається при нагріванні в поліфосфорній кислоті і приводить до 2-ациламінотіазоло[2,3-*b*]тіазолієвих солей.

Крім циклоанелювання, для похідних 2,5-діаміно-1,3-тіазолу, 5-аміно-2-іміно-2,3-дигідро-1,3-тіазолу та 5-аміно-2-гідразино-1,3-тіазолу відомі

їх перетворення, пов'язані з рециклізацією і кислотним гідролізом, що приводить до заміщених 2-тіогідантоїнів та 3-аміно-2-тіогідантоїнів [78, 79] (схема 13).

Процеси, представлені на схемі 13, відбуваються цілком спрямовано навіть в умовах однореакторного синтезу і тому можуть конкурувати з

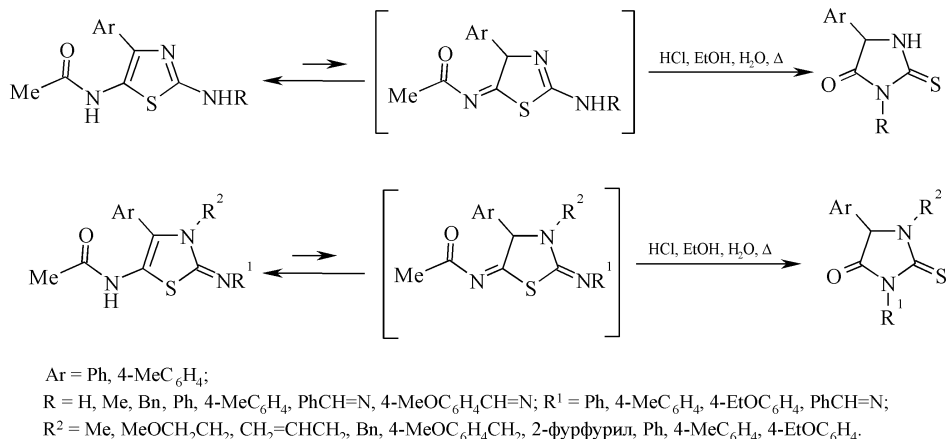


Схема 13

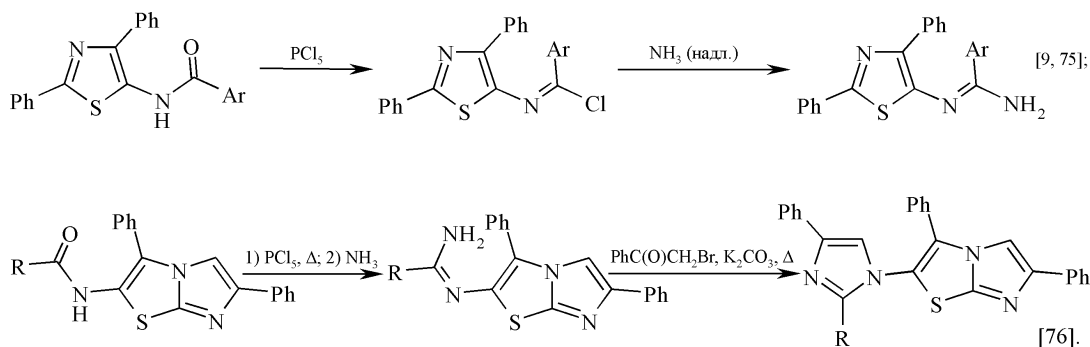
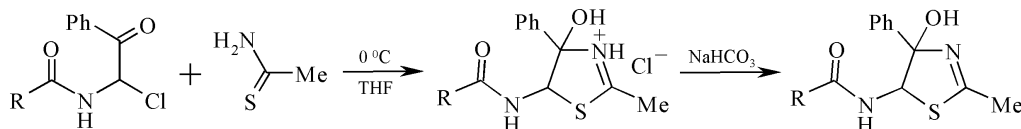


Схема 14



R = Me, Ph, MeO та ін. [3].

Схема 15

відомими способами одержання похідних 2-тіогідантоїнів на основі арилгліцинів та їх естерів. Особливо важливим є регіоселективне введення різних замісників до обох атомів азоту 2-тіогідантоїнової системи, що має явне препаративне значення.

Таким чином, циклоконденсація Ганча за участю амідфенацилюючих агентів та різноманітних тіоамідних субстратів — важливий підхід до синтезу багатьох 5-ациламінозаміщених 1,3-тіазолів, які до того ж нерідко містять неординарні замісники в положенні 2 і тому їх важко або неможливо отримати іншими способами. Деацилювання цих сполук має препаративне значення лише в окремих випадках. Значно цікавішим є перетворення ациламінічних залишків біля центру C^5 тіазольного кільця або біля центру C^2 імідазо[2,1-*b*]тіазольної системи на інші реакційноздатні групи, наприклад, схема 14.

Варто відзначити, що амідфенацилюючі реагенти є значно сильнішими електрофілами, ніж бромоацетофенон. Реакція Ганча починається вже при 0°C , що дозволяє виділити в деяких випадках проміжні продукти (схема 15).

Зрозуміло, що можливість проведення циклізації Ганча в дуже м'яких умовах обумовлена впливом на зв'язок C—Cl не лише сусідньої карбонільної групи, але й амідного фрагменту. Крім 5-ациламінозаміщених 1,3-тіазолів на основі амідфенацилюючих реагентів вдалося отримати і нові ациламінозаміщені похідні 1,3-оксазолу та імідазолу (схеми 16 та 17). Циклізація 11-1 не викликає особливих сумнівів, бо подібна на відому взаємодію α -етилтіо- α -хлороацетону з роданидом калію [80]. Крім того, будова кінцевих продуктів взаємодії амідфенацилюючих реагентів з роданидом натрію узгоджується з даними ІЧ та ЯМР ^1H спектрів, які свідчать про те, що в цьому перетворенні бере участь карбонільна група фенацильного фрагменту, а також угруповання

$\text{CH}_2\text{—NH}_2$ з утворенням 4-ациламіно-5-арил-1,3-оксазол-2(3*H*)-тіонів. Вони легко метилуються в присутності триетиламіну, що використано для одержання не лише 4-ациламіно-2-метилтіо-1,3-оксазолів, але й відповідних 2-метилзаміщених аналогів (підхід 11-2) [9].

Цікавих перетворень зазнають *S*-заміщені похідні 4-ациламіно-2-меркапто-1,3-оксазолів при нагріванні у поліфосфорній кислоті до 140°C , які привели до своєрідних похідних 1,3-оксазолу, що містять біля центру C^4 біофорні замісники з фрагментом тіазолін-2-ону або тіазолідин-2,4-діону (перетворення 11-3÷11-5) [9, 81]. Будову кінцевих продуктів цих складних процесів надійно встановлено за допомогою методик NOESY, HMQC та НМВС спектроскопії гетероядерного магнітного резонансу.

Відносно циклоконденсацій амідфенацилюючих агентів, представлених на схемі 17, зауважимо, що вони дуже подібні на взаємодію бромоацетофенону з гідрохлоридом бензамідину, яку описав Ф.Кункель ще в 1901 р. [82]. Проте конденсації звичайних α -галогенокарбонільних сполук з амідинами, зрозуміло, не можуть привести до введення ациламіногруп в імідазольне кільце. Тому застосування амідфенацилюючих реагентів типу $\text{ArCOCH}_2\text{NHCOR}$ для конденсацій з амідинами має препаративний інтерес, так як відомо всього кілька 5(4)-ациламінозаміщених імідазолів, синтезованих складними способами (порівн. [83]). Хоча регіоселективність циклізації 12-2 не було однозначно доведено, все ж таки за аналогією з напрямком подібної циклоконденсації на основі бромоацетофенону можна вважати, що незаміщений атом азоту амідинного субстрату взаємодіє з карбонільною групою, а заміщений атом азоту атакує зв'язок C—Cl амідфенацилюючого реагенту.

Подібним чином взаємодіють амідфенацилюючі засоби з аналогами бензамідину — 2-аміноазолами і 2-аміноазидами (схеми 18 і 19).

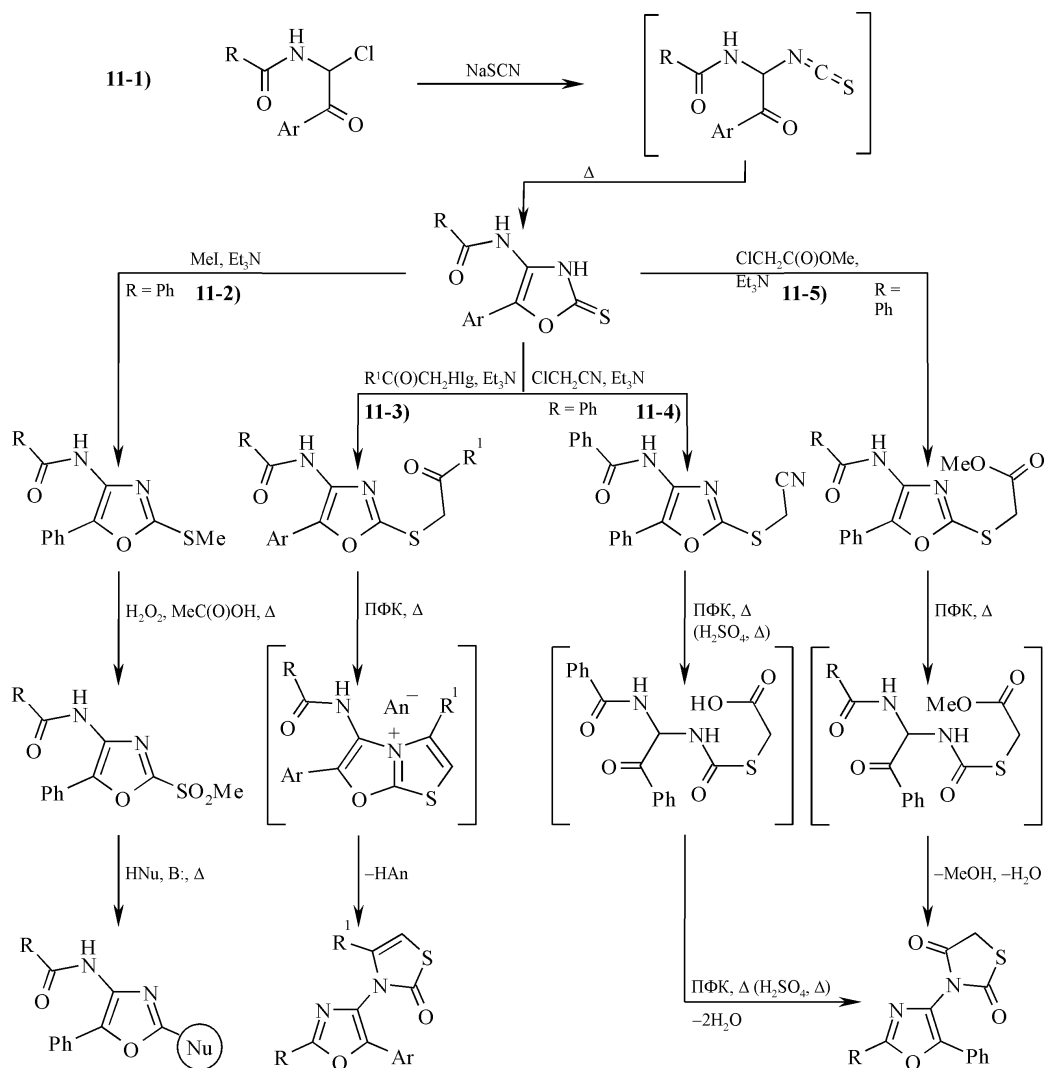
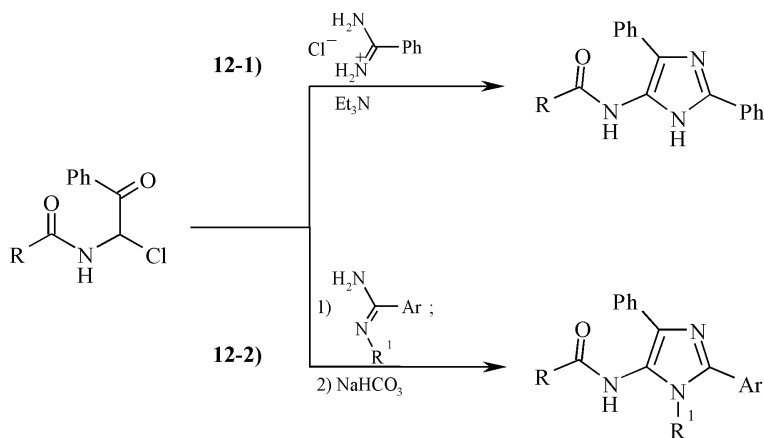


Схема 16



Ar = Ph, 4-MeC₆H₄;
 R = Me, Ph, 4-ClC₆H₄, MeO, BnO та ін.; R¹ = 4-MeC₆H₄, 2,4-дифеніл-1,3-тіазол-5-іл [9, 75].

Схема 17

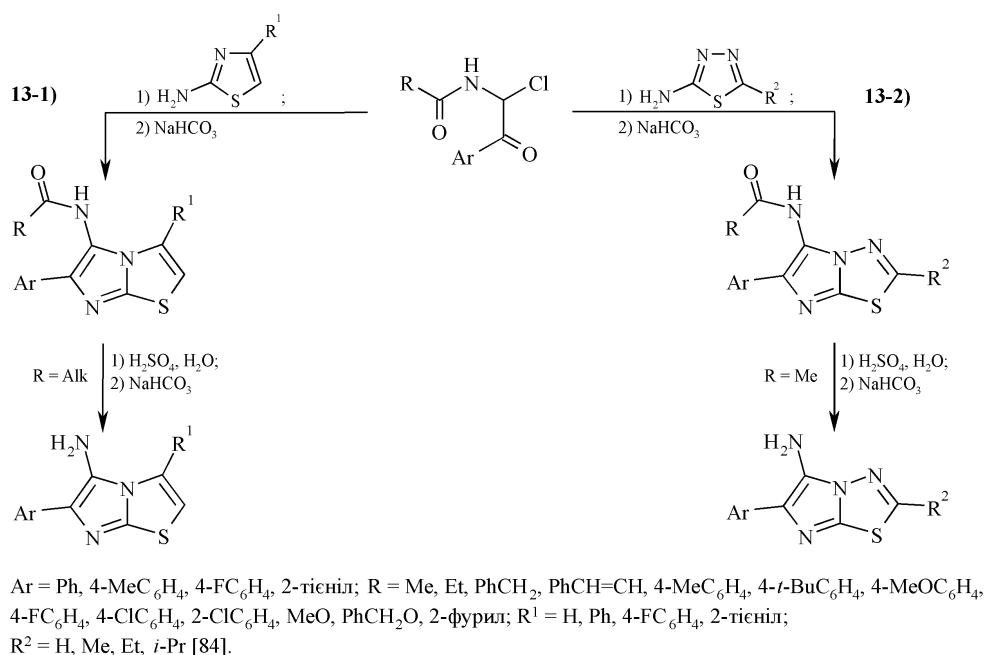


Схема 18

Вперше такі циклізації вивчалися І.Долгушиною ще в 1974 р. [11], і лише недавно сфера їх застосування була суттєво розширена О.Белогою [13, 84]. Регіоселективність циклоконденсацій схем 18 і 19 надійно встановлено за допомогою хімічних і рентгеноструктурних досліджень. В усіх цих випадках електрофільний центр зв'язку С—Сl амідофенацилюючих реагентів атакує атом азоту гетероциклічного кільця 1,3-тіазолу, 1,3,4-тіадіазолу, піридину або піримідину, а первинна аміногрупа цих субстратів взаємодіє з карбонільною групою електрофільного агента.

Зручний спосіб спрямованого введення ациламіногруп у положення 5 двох імідазоазольних систем і в положення 3 двох імідазоазинових систем представляє двоякий інтерес.

З одного боку, ті з продуктів циклізації, які містять біля екзоциклічного атома азоту залишки

оцтової або *О*-бензилвугільної кислоти, легко деацилюються у кислотному середовищі, що використано для препаративного отримання відповідних 5-аміноімідазоазолів і 3-аміноімідазоазинів.

З іншого боку, перетворення схем 18 та 19 цілком спрямовані і мають важливе значення для препаративного одержання багатьох потенційних біорегуляторів гетероциклічного ряду.

Нарешті звернемо увагу на конденсації α -ациламіно- α -гелогенокарбонільних сполук з *o*-фенілендіаміном та його гетероциклічними аналогами. На схемі 20 наведено три приклади таких циклоконденсацій, в яких ациламініні залишки не беруть участі в утворенні проміжної дигідропіризинові системи, але сприяють її ароматизації на кінцевій стадії процесу.

При заміні *o*-фенілендіаміну більш реакційноздатним *o*-аміноіофенолом ароматизація конден-

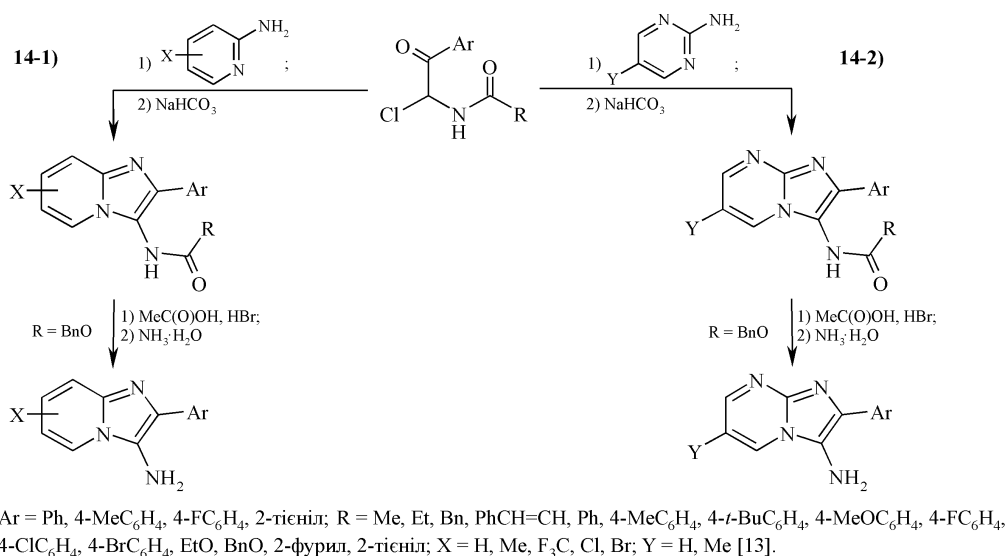


Схема 19

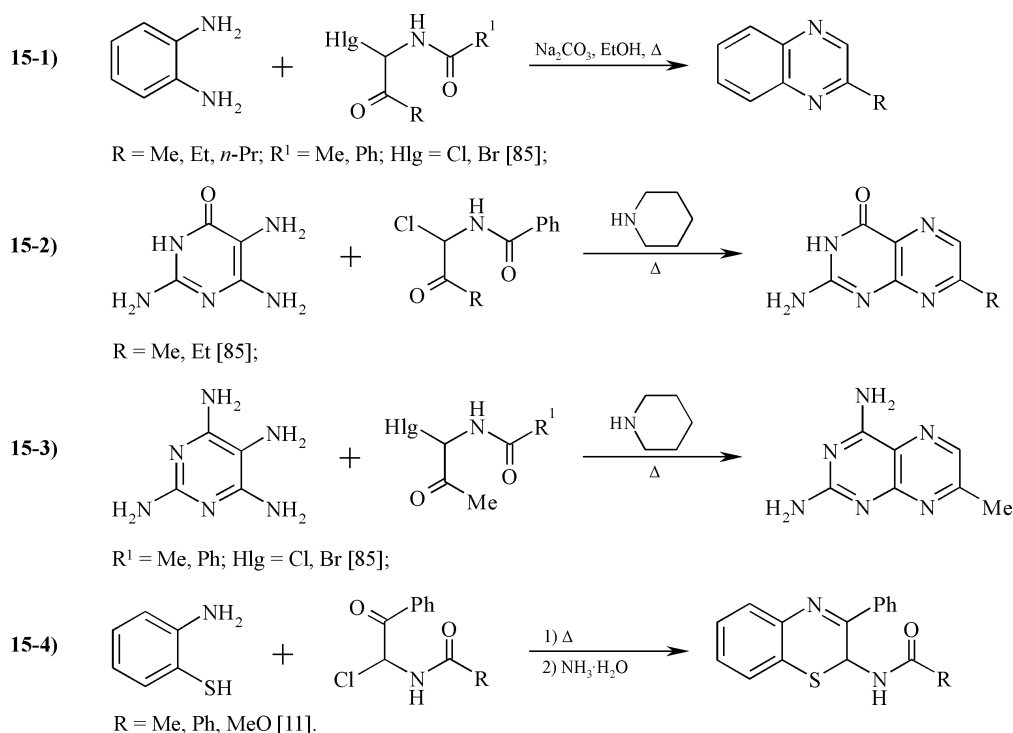


Схема 20

сованої системи неможлива і тому одержують відповідні 2-ациламінозаміщені похідні 3-фенілбензо[1,4]тіазину (циклізація 15-4).

5. Циклоконденсації α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук та їх похідних за участю амідної групи

На відміну від циклоконденсацій амідофенацільюючих реагентів з двоцентровими нуклеофілами, які розглянуто вище, у цьому розділі звернемо увагу на такі циклізації сполук A^1 , які відбуваються в результаті їх послідовної обробки нуклеофільними та електрофільними агентами, що обумовлює участь ациламінічних залишків у генерації гетероциклічної системи, наприклад, схема 21.

Таким чином вдається синтезувати найчастіше 4-функціональнозаміщені 1,3-оксазоли (E^1 , $X = O$) і рідше — похідні 1,3-тіазолу (E^1 , $X = S$).

Зупинимось, насамперед, на проміжних продуктах, які утворюються при обробці α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук кисне- або сірковмісними нуклеофілами. В літературі описані численні випадки заміщення рухливого атома хлору в реагентах A^1 та їх аналогах на відповідні кисневмісні групи при їх обробці водою [8, 15, 86], спиртами [7, 20, 87, 88], фенолами [8, 12], карбоновими кислотами [14, 88]. Проте лише незначна

частина одержаних продуктів придатна для циклізації (схема 22).

Для прикладу вкажемо на перетворення 16-1, яке є препаративним способом синтезу 2-алкіл(арил)-4-хлоро-1,3-оксазолів. Проміжні продукти цього перетворення — α -ациламіно- α -гідроксиацетофенони хоча і можна одержати гідролізом відповідних амідофенацільюючих реагентів A^1 , але зручніше їх синтезувати безпосередньо з арилглюксалів (схема 4).

Значно частіше реагенти A^1 та їх аналоги застосовувались для одержання похідних 4-меркапто-1,3-оксазолу та 4-меркапто-1,3-тіазолу. При цьому важливі проміжні продукти S -амідофенацільювання одержані взаємодією реагентів A^1 з сірководнем, меркаптанами, тіофенолами та аренсульфінатами натрію. Гетероциклізації цих проміжних продуктів найчастіше здійснювались за допомогою пентахлориду фосфору або реагенту Лоусона (схема 22).

Проте значна кількість ациклічних продуктів, одержаних взаємодією α -ациламіно- α -галогенокарбонільних сполук з різноманітними тіолами [20, 53, 87, 88, 92], ксантогенатом калію [1, 2, 8, 93] та аренсульфінатами натрію [5, 20, 94], ще не використана для одержання функціоналізованих гетероциклів. Ще менше для циклізації застосо-

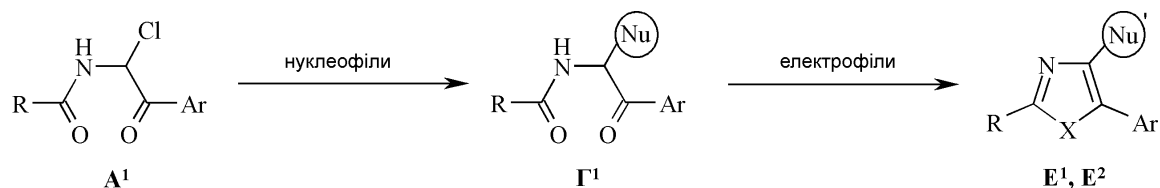


Схема 21

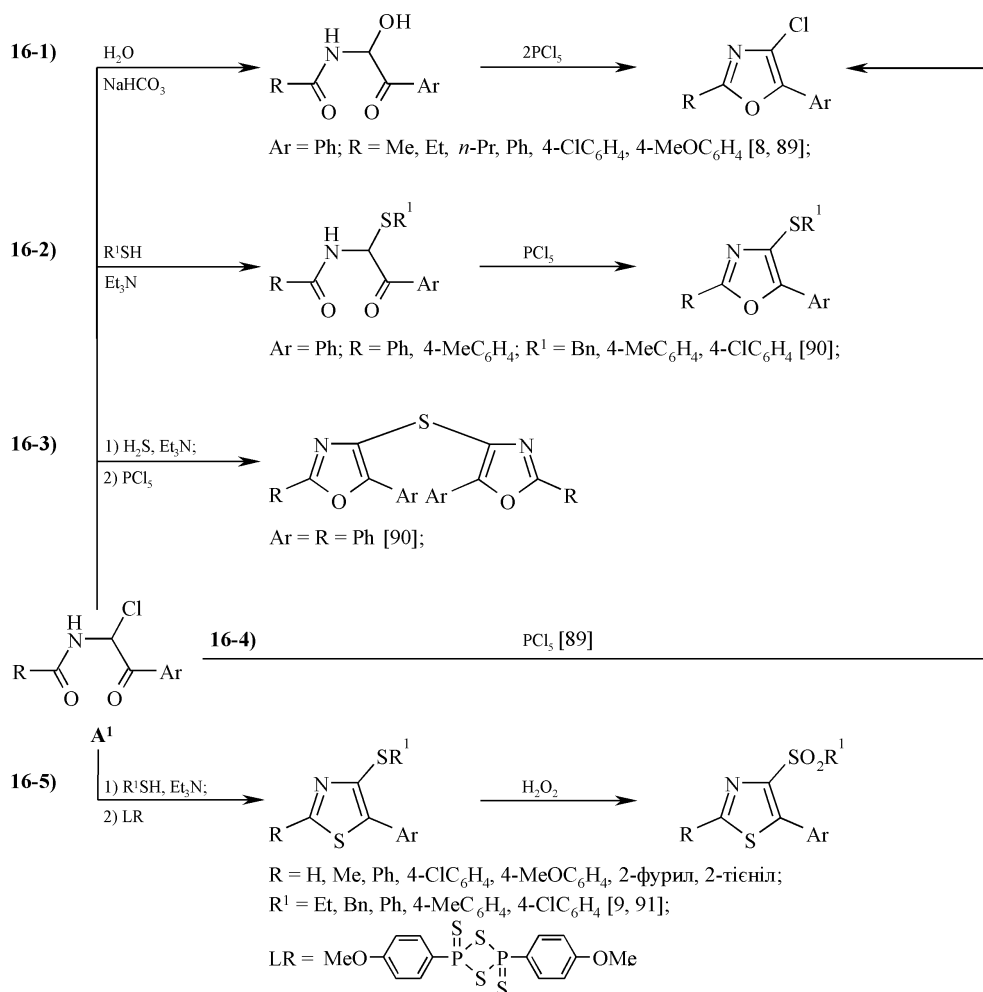
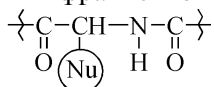


Схема 22

увались продукти *N*-амідофенацилювання та їх аналоги. Відомо, що різні типи α-ациламіно-α-галогенокарбонільних сполук легко взаємодіють з аміаком [26, 38, 95, 96], первинними аліфатичними та ароматичними амінами [1, 22, 38, 87, 97, 98], вторинними амінами та морфоліном [1, 2, 22, 36, 38, 41], гідроксиламіном і фенілгідразином [38], а також азотистими гетероциклічними основами: імідазолом [16, 99], бензімідазолом [16], 1,2,4-триазолом [16, 99], тетразолом [99], піразолом [16, 99], урацилом [100, 101] та 5-метилурацилом [102].

Проте більшість одержаних сполук з характерним фрагментом



не використовувалась для гетероциклізацій. Винятком є продукти *N*-амідофенацилювання амідів карбонових кислот, які можна одержати з реагентів A¹ [1, 2], але зручніше їх отримувати безпосередньо з арилпліоксалів (схема 23).

Перетворення 17-1 та 17-2 — препаративні способи одержання 4-ациламіно-1,3-оксазолів та продуктів їх подальшої модифікації.

Крім того, препаративне значення мають і циклізації продуктів *N*-амідофенацилювання урацилу

та його аналогів [101-105]. Зі схеми 24 видно, що підходи 18-1 та 18-2 дають можливість вводити заміщені оксазолільні або тіазолільні фрагменти в положення 1 чи 3 деяких піримідинових основ.

Ряд інших подібних перетворень узагальнено в дисертаційній роботі С.Ключко [104].

Крім певних продуктів *N*-амідофенацилювання, для гетероциклізації були використані і подібні продукти *P*- та *C*-амідофенацилювання (схеми 25, 27). Так, реагенти A¹ легко вступають у перегруповання Арбузова з триалкілфосфітами та етиловим естером дифенілфосфіністої кислоти, що дає такі фосфоровмісні проміжні сполуки, які легко перетворюються при дії оцтового ангідриду, тіонілхлориду чи пентахлориду фосфору на відповідні 4-фосфорильовані 2,5-діарил-1,3-оксазоли (підходи 19-1 та 19-2).

Слід проте звернути увагу на те, що крім продуктів *P*-амідофенацилювання, представлених на схемі 25, синтезовано значну кількість α-фосфорильованих похідних естерів α-ациламіногліцинів загальної формули Є (схема 26), які не знайшли поки що застосування для гетероциклізацій. Зрозуміло, що взаємодія цих субстратів з електрофільними реагентами приведе до глибоких змін у біофорних фрагментах сполук Є. Однак не виклю-

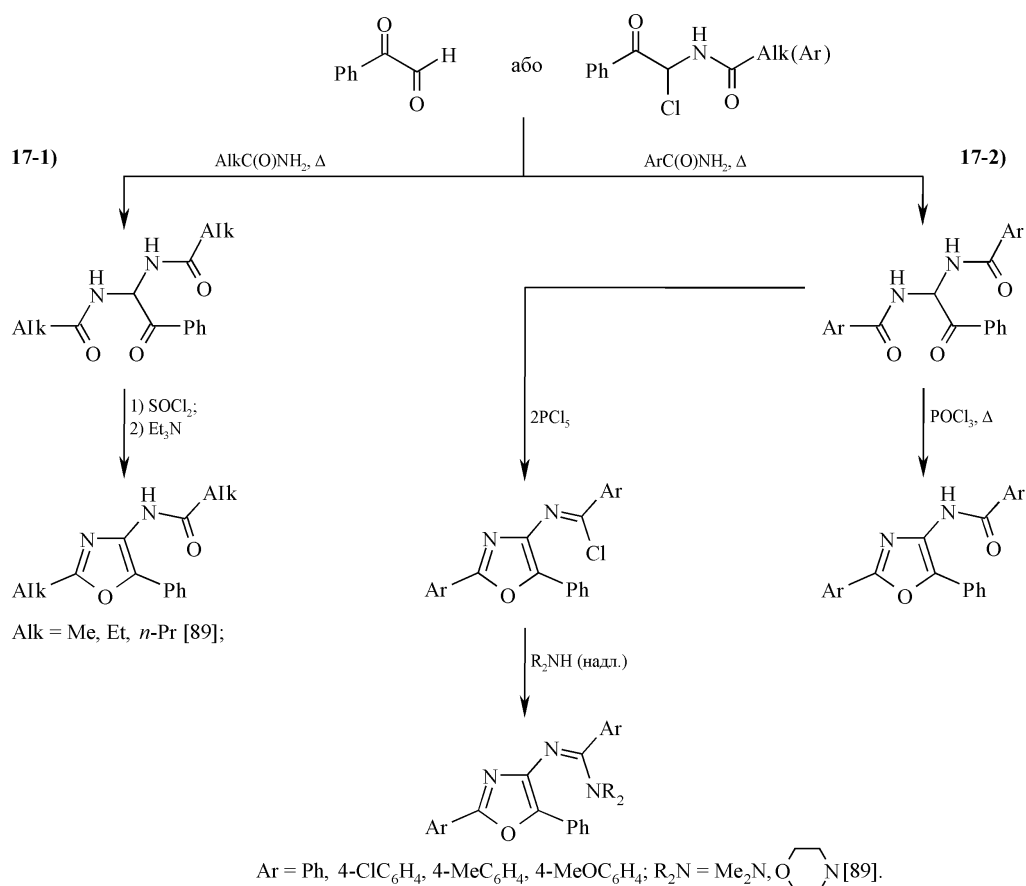


Схема 23

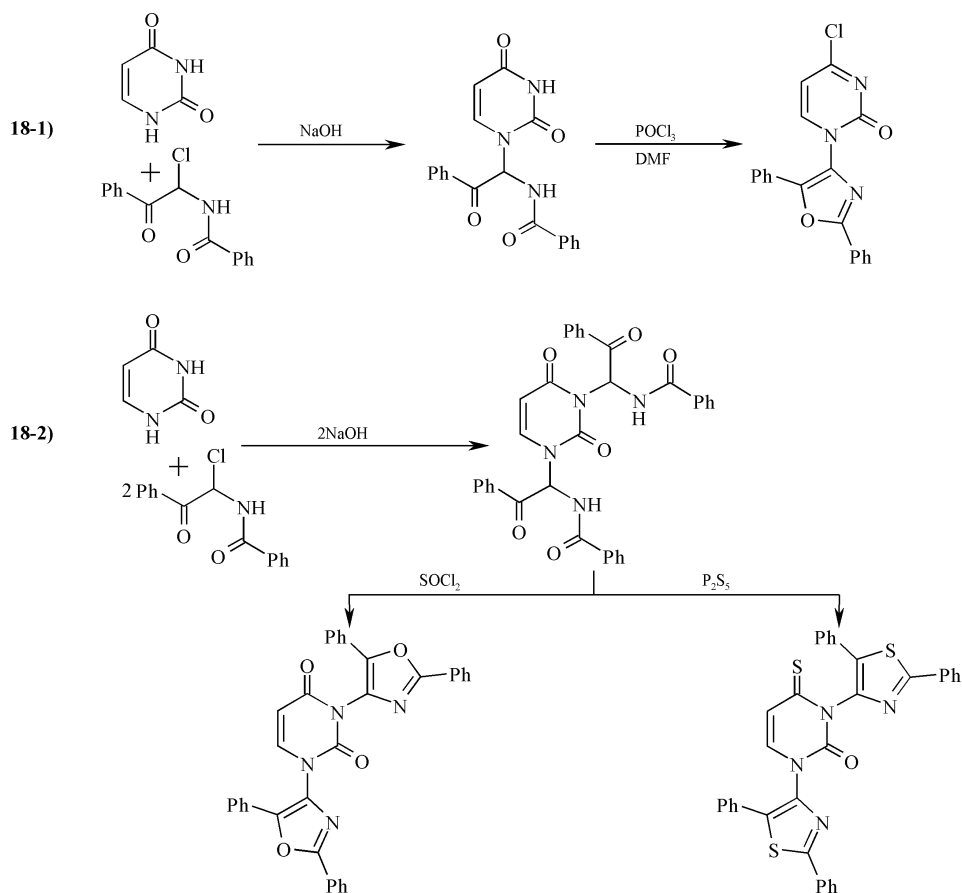


Схема 24 [101]

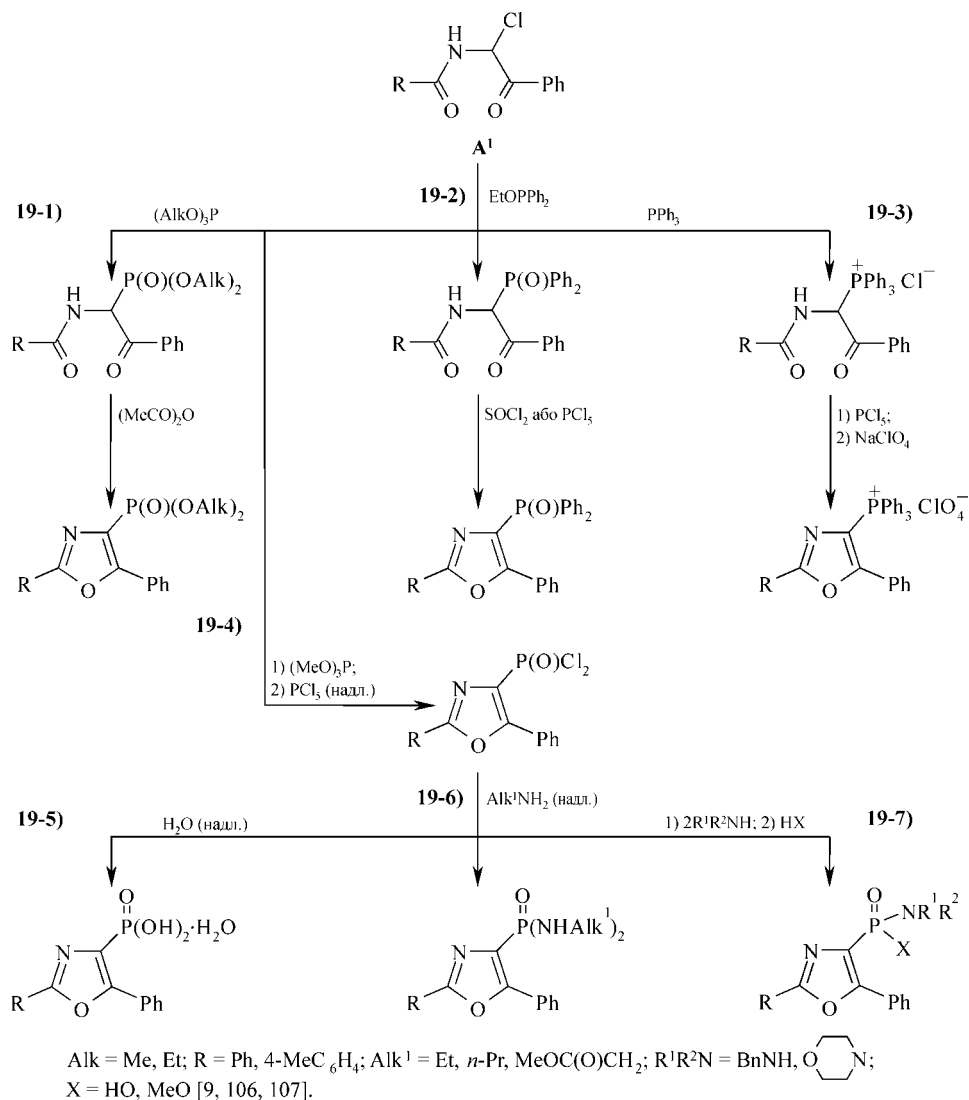


Схема 25

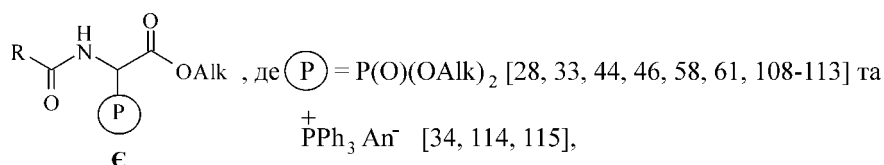


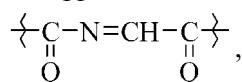
Схема 26

чено, що при цьому вдається отримати такі реакційні проміжні продукти, які будуть незамінними для синтезу важливих фосфорильованих похідних азотистих гетероциклів, які також будуть біофорними.

Зауважимо, насамкінець, що численні α -ациламіно- α -галогенокарбонільні сполуки вводились у конденсації з різними *S*-нуклеофілами: Na- або K-похідними сполук з активною метиленовою групою [23, 25, 59, 62, 116-120], *S*-літєвими похідними різноманітних сполук з рухливим атомом водню [29, 39, 99, 121-123], магнійорганічними сполуками [47, 48, 54, 124-128], оловоорганічними сполуками [19, 129-137], вініловими етерами та естерами [50, 55, 56, 59, 138-142], енамінами [35, 45, 54], енамідами [143], триметилсилільними по-

хідними ненасичених сполук [21, 65, 144-146], електронозбагаченими гетероциклічними системами [147-149], фосфонієвими ілідами [150] та іншими субстратами. При цьому завжди утворюється принаймні один новий зв'язок C—C, але гетероциклізації відбуваються лише зрідка (схема 27).

Цікаво, що проміжними продуктами більшості перетворень схеми 27 є сильні електрофіли — *N*-ациліміни α -дикарбонільних сполук з характерним фрагментом



який вступає в реакцію циклоприєднання по зв'язку C=N з електронодонорними ненасиченими сполуками і в тому числі з циклопентадієном

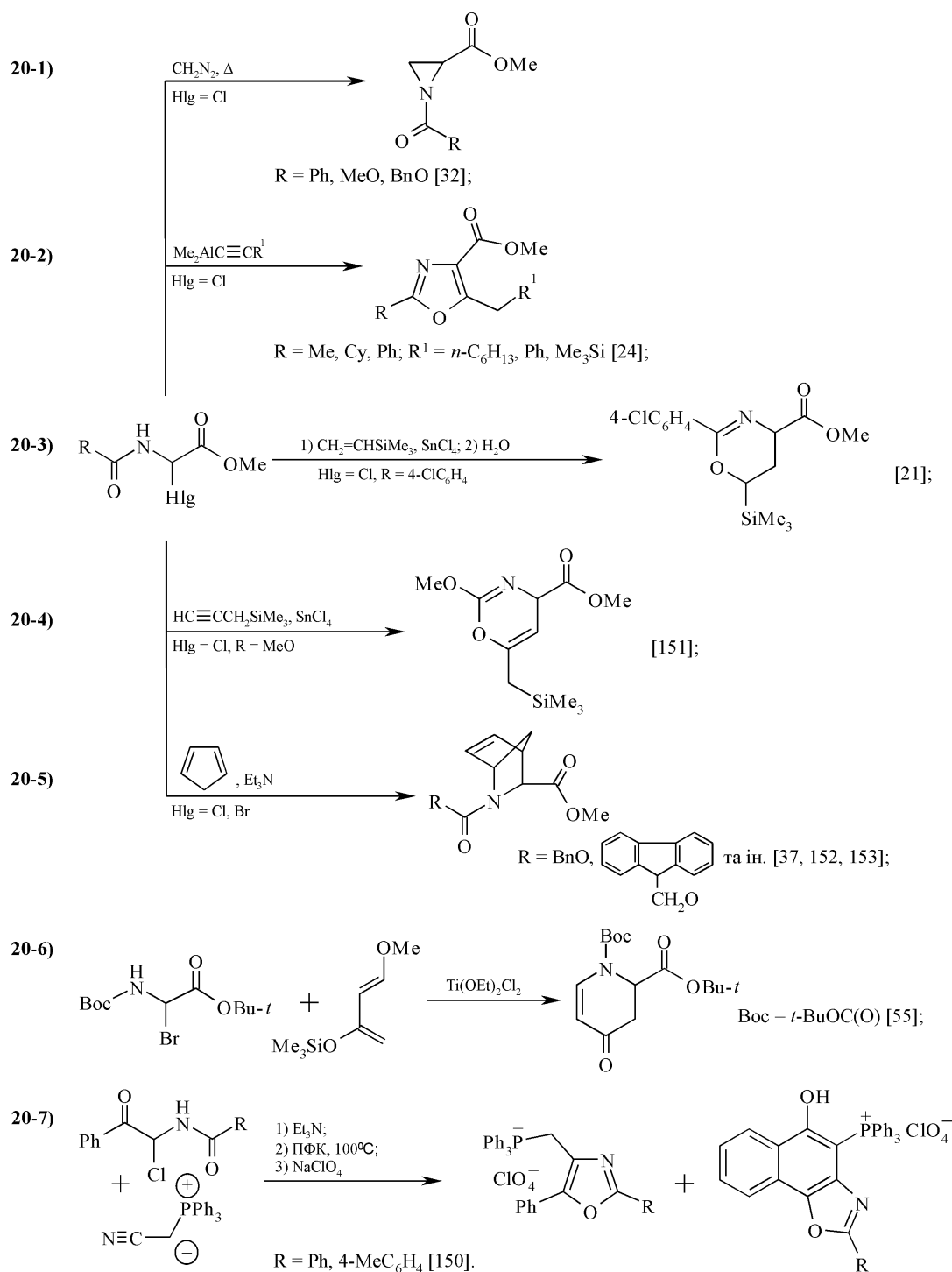


Схема 27

та дієном Данішевського. В останніх двох реакціях реалізується своєрідний випадок реакції Дільса-Альдера (перетворення 20-5, 20-6).

Препаративне значення, крім циклоприєднань 20-5 та 20-6, має, очевидно, синтез 1,2-діацильних похідних азиридину за способом 20-1.

Література

1. Matthies D. // Arch. Pharm. (Weinheim). — 1968. — Vol. 301, №11. — P. 867-872.
2. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Курсанов А.В. // ЖОРХ. — 1972. — Т. 8, №6. — С. 1224-1227.

Висновки

Зроблено детальний огляд літератури стосовно способів одержання α -ациламіно- α -галогенкарбонільних сполук та їх гетероциклізації як без участі амідної групи, так і за її участі.

3. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Кирсанов А.В. // *ЖОрХ*. — 1973. — Т. 9, №2. — С. 414-419.
4. Mathies D., Wolff R. // *Pharm. Acta Helv.* — 1973. — Vol. 48, №1. — P. 44-50. Цит. за: С.А. — 1973. — Vol. 79. — P. 5280g.
5. Matthies D. // *Z. Naturforsch.* — 1973. — Vol. 28c, №1-2. — P. 100-102.
6. Matthies D. // *Arch. Pharm. (Weinheim)*. — 1974. — Vol. 307, №10. — P. 801-805.
7. Matthies D. // *Arch. Pharm. (Weinheim)*. — 1975. — Vol. 308, №12. — P. 964-969.
8. Долгушина И.Ю. *N-Ацильные производные ω-хлор-ω-амидоацетофенона: Дис. ... канд. хим. наук.* — К., 1975. — 107 с.
9. Белога О.Г. *Синтези біоактивних похідних азотистих гетероциклів на основі амідо-фенацільюючих реагентів: Дис. ... канд. хім. наук.* — К., 2006. — 167 с.
10. Nardi D. // *Boll. Chim. Farm.* — 1965. — Vol. 104, №2. — P. 94-104. Цит. за: С.А. — 1965. — Vol. 62. — P. 14552b.
11. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Синица А.Д. // *ХГС*. — 1974. — №7. — С. 928-931.
12. Matthies D., Bartsch B., Blanck U. // *Arch. Pharm. (Weinheim)*. — 1985. — Vol. 318, №5. — P. 473-475.
13. Белога А.Г., Броварец В.С., Чернега А.Н. и др. // *ЖОФХ*. — 2004. — Т. 2, №4. — С. 25-31.
14. Matthies D., Bartsch B., Richter H. // *Arch. Pharm. (Weinheim)*. — 1981. — Vol. 314, №3. — P. 209-217.
15. Malassa I., Matthies D. // *Lieb. Ann.* — 1986. — №7. — P. 1133-1139.
16. Matthies D. // *Synthesis*. — 1972. — №7. — P. 380.
17. Pearson N.D., Smale T.C., Southgate R. // *Tetrahedron Lett.* — 1995. — Vol. 36, №25. — P. 4493-4496.
18. Рилей Х., Грей А. *Фенилглиоксаль. Синтезы органических препаратов / Под ред. А.Блэтта; пер. с англ. А.Ф.Платэ.* — М., 1949. — Сб. 2. — С. 507-509.
19. Williams R.M., Aldous D.J., Aldous S.C. // *J. Org. Chem.* — 1990. — Vol. 55, №15. — P. 4657-4663.
20. Matthies D. // *Synthesis*. — 1978. — №1. — P. 53-54.
21. Ebeling S., Matthies D., McCarthy D. // *Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elem.* — 1991. — Vol. 60, №3-4. — P. 265-273.
22. Matthies D. // *Pharmazie*. — 1970. — Vol. 25, №9. — P. 522-524.
23. Dudding T., Hafez A.M., Taggi A.E. et al. // *Org. Lett.* — 2002. — Vol. 4, №3. — P. 387-390.
24. Coqueron P.-Y., Didier C., Ciufolini M.A. // *Angew. Chem., Int. Ed.* — 2003. — Vol. 42, №12. — P. 1411-1414.
25. Hafez A.M., Dudding T., Wagerle T.R. et al. // *J. Org. Chem.* — 2003. — Vol. 68, №15. — P. 5819-5825.
26. Long K., Boyce M., Lin H. et al. // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* — 2005. — Vol. 15, №17. — P. 3849-3852.
27. Ebeling S.C., Matthies D. // *J. Pr. Chem.* — 1994. — Vol. 336, №3. — P. 271-272.
28. Daumas M., Vo-quang L., Le Goffic F. // *Synth. Commun.* — 1990. — Vol. 20, №22. — P. 3395-3401.
29. Alks V., Sufrin J.R. // *Synth. Commun.* — 1989. — Vol. 19, №9-10. — P. 1479-1486.
30. Durand P., Richard P., Renaut P. // *J. Org. Chem.* — 1998. — Vol. 63, №26. — P. 9723-9727.
31. Durand P., Peralba P., Renaut P. // *Tetrahedron*. — 2001. — Vol. 57, №14. — P. 2757-2760.
32. Bernstein Z., Ben-Ishai D. // *Tetrahedron*. — 1977. — Vol. 33, №8. — P. 881-883.
33. Apitz G., Steglich W. // *Tetrahedron Lett.* — 1991. — Vol. 32, №27. — P. 3163-3166.
34. Zeitler K., Steglich W. // *J. Org. Chem.* — 2004. — Vol. 69, №18. — P. 6134-6136.
35. Apitz G., Jager M., Jaroch S. et al. // *Tetrahedron*. — 1993. — Vol. 49, №36. — P. 8223-8232.
36. Yoo B., Pagel M.D. // *Tetrahedron Lett.* — 2006. — Vol. 47, №41. — P. 7327-7330.
37. Prenzel A.H.G.P., Deppermann N., Maison W. // *Org. Lett.* — 2006. — Vol. 8, №8. — P. 1681-1684.
38. Kohn H., Sawhney K.N., LeGall P. et al. // *J. Med. Chem.* — 1991. — Vol. 34, №8. — P. 2444-2452.
39. Bardel P., Bolanos A., Kohn H. // *J. Med. Chem.* — 1994. — Vol. 37, №26. — P. 4567-4571.
40. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Синица А.Д. // *ЖОХ*. — 1975. — Т. 45, №11. — С. 2387-2390.
41. Завьялов С.И., Ежова Г.И. // *Изв. АН СССР. Сер. хим.* — 1983. — №9. — С. 2079-2084.
42. Hilton S.T., Motherwell W.B., Potier P. et al. // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* — 2005. — Vol. 15, №9. — P. 2239-2242.
43. Завьялов С.И., Завозин А.Г., Кравченко Н.Е. и др. // *Изв. АН СССР. Сер. хим.* — 1984. — №12 — С. 2756-2759.
44. Kober R., Steglich W. // *Lieb. Ann.* — 1983. — №4. — P. 599-609.
45. Kober R., Papadopoulos K., Miltz W. et al. // *Tetrahedron*. — 1985. — Vol. 41, №9. — P. 1693-1701.
46. Oba M., Ueno R., Fukuoka M. et al. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*. — 1995. — №12. — P. 1603-1609.
47. Trost B.M., Lee C. // *J. Am. Chem. Soc.* — 2001. — Vol. 123, №49. — P. 12191-12201.
48. Biagini S.C.G., Gibson S.E., Keen S.P. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*. — 1998. — №16. — P. 2485-2499.
49. Armstrong A., Edmonds I.D., Swarbrick M.E. et al. // *Tetrahedron*. — 2005. — Vol. 61, №35. — P. 8423-8442.
50. Rowley M., Leeson P.D., Williams B.J. et al. // *Tetrahedron*. — 1992. — Vol. 48, №17. — P. 3557-3570.
51. Lloris M.E., Moreno-Manas M. // *Tetrahedron Lett.* — 1993. — Vol. 34, №44. — P. 7119-7122.
52. Caputo F., Clerici F., Gelmi M.L. et al. // *Tetrahedron*. — 2006. — Vol. 62, №6. — P. 1288-1294.
53. Repine J.T., Kaltenbronn J.S., Doherty A.M. et al. // *J. Med. Chem.* — 1992. — Vol. 35, №6. — P. 1032-1042.
54. Munster P., Steglich W. // *Synthesis*. — 1987. — №3. — P. 223-225.
55. Hartmann P., Obrecht J.-P. // *Synth. Commun.* — 1988. — Vol. 18, №6. — P. 553-557.
56. Muhlemann C., Hartmann P., Obrecht J.-P. *Organic Syntheses / Ed. L.E.Overman.* — New York, 1993. — Vol. 71. — P. 200-206.
57. Ermert P., Meyer J., Stucki C. et al. // *Tetrahedron Lett.* — 1988. — Vol. 29, №11. — P. 1265-1268.
58. Narukawa Y., Juneau K.N., Snustad D. et al. // *J. Org. Chem.* — 1992. — Vol. 57, №20. — P. 5453-5462.
59. Bretschneider T., Miltz W., Munster P. et al. // *Tetrahedron*. — 1988. — Vol. 44, №17. — P. 5403-5414.
60. Croft A.K., Easton C.J., Kociuba K. et al. // *Tetrahedron: Asymmetry*. — 2003. — Vol. 14, №19. — P. 2919-2926.

61. Davies S.G., Rodriguez-Solla H., Tamayo J.A. et al. // *Org. Biomol. Chem.* — 2005. — Vol. 3, №8. — P. 1435-1447.
62. Allmendinger T., Rihs G., Wetter H. // *Helv. Chim. Acta.* — 1988. — Vol. 71, №2. — P. 395-403.
63. Easton C.J., Hutton C.A., Rositano G. et al. // *J. Org. Chem.* — 1991. — Vol. 56, №19. — P. 5614-5618.
64. Furenes E.B., Luijendijk J., Efskind J. et al. // *Synth. Commun.* — 2005. — Vol. 35, №2. — P. 193-200.
65. Ebeling S.C. // *J. Pr. Chem.* — 1994. — Vol. 336, №4. — P. 330-332.
66. Easton C.J., Tan E.W., Hay M.P. // *Chem. Commun.* — 1989. — №7. — P. 385-386.
67. Easton C.J., Scharfbillig I.M., Tan E.W. // *Tetrahedron Lett.* — 1988. — Vol. 29, №13. — P. 1565-1568.
68. Ricci M., Madariaga L., Skrydstrup T. // *Angew. Chem., Int. Ed.* — 2000. — Vol. 39, №1. — P. 242-246.
69. Ricci M., Blakskj?r P., Skrydstrup T. // *J. Am. Chem. Soc.* — 2000. — Vol. 122, №50. — P. 12413-12421.
70. Blakskj?r P., Pedersen L., Skrydstrup T. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I.* — 2001. — №8. — P. 910-915.
71. Смолий О.Б., Панчишин С.Я., Пироженко В.В. и др. // *ЖОХ.* — 2001. — Т. 71, №11. — С. 1830-1832.
72. Выджак Р.Н., Броварец В.С., Пильо С.Г. и др. // *ЖОХ.* — 2002. — Т. 72, №2. — С. 226-230.
73. Выджак Р.Н., Даниелова А.А., Киселев В.В. и др. // *ЖОХ.* — 2005. — Т. 75, №6. — С. 1002-1006.
74. Сливчук С.Р., Броварец В.С., Драч Б.С. // *ЖОФХ.* — 2005. — Т. 3, №1. — С. 25-32.
75. Баля А.Г., Белюга А.Г., Броварец В.С. и др. // *ЖОФХ.* — 2006. — Т. 4, №4. — С. 49-53.
76. Баля А.Г., Броварец В.С., Драч Б.С. // *ЖОФХ.* — 2007. — Т. 5, №1. — С. 50-54.
77. Баля А.Г., Броварец В.С., Драч Б.С. // *ЖОФХ.* — 2007. — Т. 5, №4. — С. 32-35.
78. Баля А.Г., Чернега А.Н., Бут С.А. и др. // *ЖОХ.* — 2008. — Т. 78, №7. — С. 1194-1202.
79. Баля А.Г., Василенко А.Н., Броварец В.С. и др. // *ЖОХ.* — 2008. — Т. 78, №11. — С. 1891-1896.
80. Weygand F., Bestmann H.J., Steden F. // *Chem. Ber.* — 1958. — Vol. 91, №11. — P. 2537-2542.
81. Balia A.G., Belyuga A.G., Brovarets V.S. et al. // *Heteroatom Chem.* — 2007. — Vol. 18, №4. — P. 432-437.
82. Kunckell F. // *Chem. Ber.* — 1901. — Vol. 34, №1. — P. 637-642.
83. Cusmano S., Ruccia M. // *Gazz. Chim. Ital.* — 1955. — Vol. 85, №11. — P. 1329-1338.
84. Белюга А.Г., Броварец В.С., Чернега А.Н. и др. // *ЖОФХ.* — 2005. — Т. 3, №4. — С. 38-42.
85. Завьялов С.И., Ежова Г.И., Будкова Т.К. // *Изв. АН СССР. Сер. хим.* — 1984. — №7. — С. 1590-1593.
86. Mooiweer H.H., Niemstra H., Speckamp W.N. // *Tetrahedron.* — 1991. — Vol. 47, №20-21. — P. 3451-3462.
87. Easton C.J., Peters S.C. // *Austral. J. Chem.* — 1990. — Vol. 43, №1. — P. 87-97.
88. Easton C.J., Peters S.C. // *Austral. J. Chem.* — 1994. — Vol. 47, №5. — P. 859-868.
89. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Сеница А.Д. // *ЖОрХ.* — 1973. — Т. 9, №11. — С. 2368-2372.
90. Харченко О.В. Застосування S-амідоалкілювання в синтезах функціональних похідних азотистих гетероциклів: Дис. ... докт. хім. наук. — Дніпропетровськ, 1999. — 352 с.
91. Белюга А.Г., Броварец В.С., Драч Б.С. // *ЖОХ.* — 2004. — Т. 74, №9. — С. 1529-1533.
92. Ключко С.В., Хутова Б.М., Приказчикова Л.П. // *ХГС.* — 1994. — №9. — С. 1234-1238.
93. Udding J.H., Niemstra H., Speckamp W.N. // *J. Org. Chem.* — 1994. — Vol. 59, №13. — P. 3721-3725.
94. Червоный В.А., Зябрев В.С., Харченко А.В. и др. // *ЖОрХ.* — 1989. — Т. 25, №12. — С. 2597-2602.
95. Trojandt G., Polborn K., Steglich W. et al. // *Tetrahedron Lett.* — 1995. — Vol. 36, №6. — P. 857-860.
96. Trojandt G., Herr U., Polborn K. et al. // *Chem. Eur. J.* — 1997. — Vol. 3, №8. — P. 1254-1268.
97. Amoroso R., Cardillo G., Tomasini C. // *Tetrahedron Lett.* — 1991. — Vol. 32, №17. — P. 1971-1974.
98. Kohn H., Sawhney K.N., Robertson D.W. et al. // *J. Pharm. Sci.* — 1994. — Vol. 83, №5. — P. 689-691.
99. Kohn H., Sawhney K.N., Bardel P. et al. // *J. Med. Chem.* — 1993. — Vol. 36, №22. — P. 3350-3360.
100. Хутова Б.М., Ключко С.В., Приказчикова Л.П. // *ХГС.* — 1991. — №4. — С. 512-515.
101. Хутова Б.М., Ключко С.В., Приказчикова Л.П. и др. // *ХГС.* — 2003. — №5. — С. 761-764.
102. Хутова Б.М., Ключко С.В., Приказчикова Л.П. и др. // *Укр. хим. журн.* — 2002. — Т. 68, №2. — С. 108-110.
103. Хутова Б.М., Ключко С.В., Приказчикова Л.П. и др. // *Укр. хим. журн.* — 1993. — Т. 59, №10. — С. 1067-1070.
104. Ключко С.В. Амидоалкилирование гидроксидов и меркаптопиримидинов: Дис. ... канд. хім. наук. — К., 1995. — 173 с.
105. Ключко С.В., Хутова Б.М., Приказчикова Л.П. и др. // *ЖОФХ.* — 2006. — Т. 4, №4. — С. 45-48.
106. Драч Б.С., Долгушина И.Ю., Сеница А.Д. // *ЖОХ.* — 1975. — Т. 45, №6. — С. 1251-1255.
107. Белюга А.Г., Броварец В.С., Драч Б.С. // *ЖОХ.* — 2005. — Т. 75, №4. — С. 561-564.
108. Kunze T. // *Arch. Pharm. (Weinheim).* — 1996. — Vol. 329, №11. — P. 503-509.
109. Debenham S.D., Cossrow J., Toone E.J. // *J. Org. Chem.* — 1999. — Vol. 64, №25. — P. 9153-9163.
110. Nakajima T., Nakayama K., Shimizu I. // *J. Label. Compd. Radiopharm.* — 2007. — Vol. 50, №5-6. — P. 622-623.
111. Vartak A.P., Skoblenick K., Thomas N. et al. // *J. Med. Chem.* — 2007. — Vol. 50, №26. — P. 6725-6729.
112. Concellon J.M., Rodriguez-Solla H., Concellon C. et al. // *Synlett.* — 2008. — №3. — P. 402-404.
113. Vaswani R.G., Chamberlin A.R. // *J. Org. Chem.* — 2008. — Vol. 73, №5. — P. 1661-1681.
114. Schumann S., Zeiler K., Jager M. et al. // *Tetrahedron.* — 2000. — Vol. 56, №25. — P. 4187-4195.
115. Ferraris D., Young B., Cox C. et al. // *J. Am. Chem. Soc.* — 2002. — Vol. 124, №1. — P. 67-77.
116. Rich D.H., Dhaon M.K. // *Tetrahedron Lett.* — 1983. — Vol. 24, №16. — P. 1671-1674.
117. Jenhi A., Laverne J.-P., Viallefont Ph. // *J. Organometal. Chem.* — 1991. — Vol. 401, №1-2. — P. C14-C16.
118. El Mahdi O., Laverne J.-P., Martinez J. et al. // *Synth. Commun.* — 1997. — Vol. 27, №20. — P. 3539-3545.
119. Zia-ul-Haq M., Arshad M., Saeed-ur-Rehman A. // *J. Chin. Chem. Soc. (Taipei).* — 2001. — Vol. 48, №1. — P. 45-48.
120. Jenhi A., Laverne J.-P., Rolland M. et al. // *Synth. Commun.* — 2001. — Vol. 31, №11. — P. 1707-1714.

121. Cahill R., Crout D.H.G., Gregorio M.V.M. et al. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I.* — 1983. — №1. — P. 173-180.
122. Burgess V.A., Easton C.J. // *Austral. J. Chem.* — 1988. — Vol. 41, №7. — P. 1063-1070.
123. Easton C.J., Roselt P.D., Tiekink E.R.T. // *Tetrahedron.* — 1995. — Vol. 51, №28. — P. 7809-7822.
124. Castelhana A.L., Horne S., Billedeau R. et al. // *Tetrahedron Lett.* — 1986. — Vol. 27, №22. — P. 2435-2438.
125. Castelhana A.L., Horne S., Taylor G.J. et al. // *Tetrahedron.* — 1988. — Vol. 44, №17. — P. 5451-5466.
126. Hamon D.P.G., Massy-Westropp R.A., Razzino P. // *Tetrahedron.* — 1992. — Vol. 48, №24. — P. 5163-5178.
127. Easton C.J., Merrett M.C., Razzino P. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2.* — 2000. — №4. — P. 693-697.
128. Jorgensen C.G., Brauner-Osborne H., Nielsen B. et al. // *Bioorg. Med. Chem.* — 2007. — Vol. 15, №10. — P. 3524-3538.
129. Burgess V.A., Easton C.J., Hay M.P. et al. // *Austral. J. Chem.* — 1988. — Vol. 41, №5. — P. 701-710.
130. Baldwin J.E., Adlington R.M., Lowe C. et al. // *Chem. Commun.* — 1988. — №15. — P. 1030-1031.
131. Williams R.M., Aldous D.J., Aldous S.C. // *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I.* — 1990. — №1. — P. 171-172.
132. Easton C.J., Scharfbillig I.M. // *J. Org. Chem.* — 1990. — Vol. 55, №1. — P. 384-386.
133. Hamon D.P.G., Razzino P., Massy-Westropp R.A. // *Chem. Commun.* — 1991. — №5. — P. 332-333.
134. Hamon D.P.G., Massy-Westropp R.A., Razzino P. // *Chem. Commun.* — 1991. — №10. — P. 722-724.
135. Yamamoto Y., Onuki S., Yumoto M. et al. // *J. Am. Chem. Soc.* — 1994. — Vol. 116, №1. — P. 421-422.
136. Hamon D.P.G., Massy-Westropp R.A., Razzino P. // *Tetrahedron.* — 1995. — Vol. 51, №14. — P. 4183-4194.
137. Yamamoto Y., Onuki S., Yumoto M. et al. // *Heterocycles.* — 1998. — Vol. 47, №2. — P. 765-780.
138. Whitten J.P., Barney C.L., Huber E.W. et al. // *Tetrahedron Lett.* — 1989. — Vol. 30, №28. — P. 3649-3652.
139. Mooiweer H.H., Ettema K.W.A., Hiemstra H. et al. // *Tetrahedron.* — 1990. — Vol. 46, №8. — P. 2991-2998.
140. Matuszczak B. // *Monatsh. Chem.* — 1997. — Vol. 128, №8-9. — P. 945-951.
141. Kobayashi S., Matsubara R., Kitagawa H. // *Org. Lett.* — 2002. — Vol. 4, №1. — P. 143-145.
142. Nakamura Y., Matsubara R., Kiyohara H. et al. // *Org. Lett.* — 2003. — Vol. 5, №14. — P. 2481-2484.
143. Matsubara R., Nakamura Y., Kobayashi S. // *Angew. Chem., Int. Ed.* — 2004. — Vol. 43, №13. — P. 1679-1681.
144. Casara P., Metcalf B.W. // *Tetrahedron Lett.* — 1978. — Vol. 19, №18. — P. 1581-1584.
145. Danzin C., Casara P., Claverie N. et al. // *J. Med. Chem.* — 1981. — Vol. 24, №1. — P. 16-20.
146. Dialer H., Steglich W., Beck W. // *Tetrahedron.* — 2001. — Vol. 57, №23. — P. 4855-4861.
147. Kohn H., Sawhney K.N., LeGall P. et al. // *J. Med. Chem.* — 1990. — Vol. 33, №3. — P. 919-926.
148. Tidwell J.H., Buchwald S.L. // *J. Am. Chem. Soc.* — 1994. — Vol. 116, №26. — P. 11797-11810.
149. Schmitt M., Bourguignon J.-J., Barlin G.B. et al. // *Austral. J. Chem.* — 1997. — Vol. 50, №7. — P. 719-726.
150. Панчишин С.Я., Смолий О.Б., Чернега А.Н. и др. // *ЖОХ.* — 2005. — Т. 75, №4. — С. 556-560.
151. Mooiweer H.H., Hiemstra H., Speckamp W.N. // *Tetrahedron.* — 1989. — Vol. 45, №14. — P. 4627-4636.
152. Gaitanopoulos D.E., Weinstock J. // *J. Heterocycl. Chem.* — 1985. — Vol. 22, №4. — P. 957-959.
153. Jager M., Polborn K., Steglich W. // *Tetrahedron Lett.* — 1995. — Vol. 36, №6. — P. 861-864.

Надійшла до редакції 05.11.2010 р.