



## СИНТЕЗ, РЕАКЦИИ И АНТИМИКРОБНАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ, СОДЕРЖАЩИХ ЦИКЛОПЕНТА[*d*]ТИЕНО[2,3-*b*]ПИРИДИНОВЫЙ ОСТАТОК И РОДСТВЕННЫЕ КОНДЕНСИРОВАННЫЕ ГЕТЕРОЦИКЛЫ<sup>1</sup>

© 2020 Remon M. Zaki\*, #, Adel M. Kamal El-Dean\*,  
Shaban M. Radwan\*, and Mahmoud A. Ammar\*

\*Chemistry Department, Faculty of Science, Assiut University, Assiut, 71516 Egypt

Поступила в редакцию 07.07.2019 г.

После доработки 29.07.2019 г.

Принята к публикации 16.09.2019 г.

В работе описан простой метод синтеза новых 4-циано-1-морфолин-4-ил-6,7-дигидро-5*H*-циклопента[*c*]пиридин-3-тиона реакцией 3-амино-1-тиоксо-1,5,6,7-тетрагидроциклопента[*c*]тиопиран-4-карбонитрила с морфолином посредством перегруппировки Димрота. 1-Амино-5-морфолин-4-ил-7,8-дигидро-6*H*-циклопента[*d*]тиено-[2,3-*b*]пиридин-2-карбоксамида, полученный двумя методами, использовали как универсальный прекурсор для синтеза новых тиенопиримидинов, конденсированных с цикlopента[*d*]пиридиновой системой. Реакция аминокарбоксамида с диэтилмалонатом, триэтилортоформаиатом и циклоалканами позволила получить соответствующие конденсированные пиримидиновые гетероциклы. С другой стороны, обработка аминокарбоксамида хлороацетил хлоридом в диоксане позволило получить хлороацетиламино производное, которое в свою очередь претерпело циклоконденсацию в реакции с уксусным ангидридом, образуя хлорометилпиримидинон. Последнее соединение использовали в реакции нуклеофильного замещения с различными азот-содержащими нуклеофилами для получения алкил- (арил-) аминотетрагидропиримидинов. Затем, обработка фениламинотетрагидропиримидинона формальдегидом в условиях реакции Манниха приводила к образованию имидазопиримидинопиридинового цикла. Сходным путем реакция фениламинотетрагидропиримидинона с хлороацетил хлоридом позволила получить новую гетероциклическую систему, а именно, цикlopентапиримидинопиридинопиразин. С другой стороны, реакция аминокарбоксамида с дисульфидом углерода в пиридине приводила к образованию оксопиримидинтиона, который алкилировали различными  $\alpha$ -галокарбонильными соединениями. Новые вещества были полностью охарактеризованы с помощью элементного анализа и спектральными методами. Некоторые из полученных соединений показали высокую антибактериальную и противогрибковую активности в экспериментах *in vitro*.

**Ключевые слова:** цикlopентатиенопиридин, пиримидин, пиразин, имидазол, синтез, антимикробная активность

**DOI:** 10.31857/S0132342320010170

<sup>1</sup> Полный текст статьи печатается в английской версии журнала.

# Автор для связи: (эл. почта: remon.asal2015@gmail.com; rasal@aun.edu.eg).