

УДК 547.298.398.582

УСПЕХИ ХИМИИ АМИДИНОВ

Граник В. Г.

В статье обобщены данные, появившиеся в литературе за период 1971—1981 гг. по синтезу, физико-химическим и химическим свойствам различного типа амидиновых систем. Особое внимание удалено использованию амидинов в синтезе гетероциклов.

Библиография — 259 ссылок.

ОГЛАВЛЕНИЕ

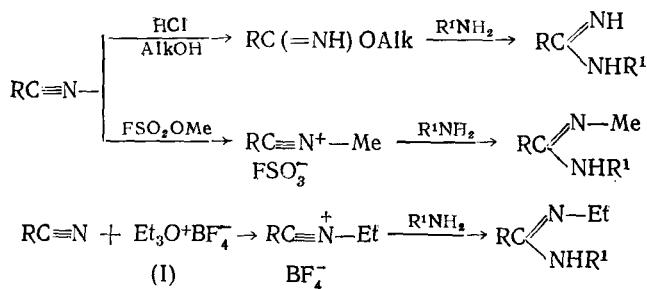
I. Введение	669
II. Методы синтеза	669
III. Строение и физико-химические свойства	678
IV. Химические свойства	681

I. ВВЕДЕНИЕ

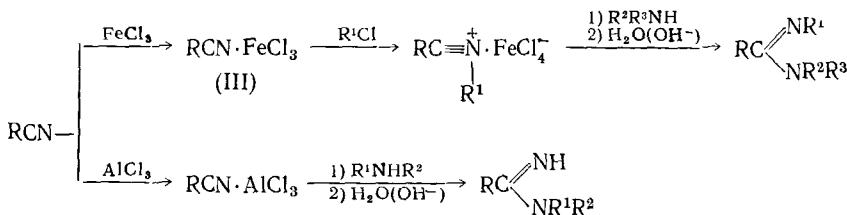
В настоящее время химия амидинов привлекает значительный интерес исследователей в связи с широким использованием этого класса соединений в органическом синтезе. Число публикаций, касающихся изучения путей синтеза и свойств амидинов постоянно возрастает и, несмотря на появившуюся в 1975 г. монографию [1] и ряд обзоров, в которых рассмотрены различные аспекты химии этих соединений [2—7], большая часть материала, опубликованного за последнее десятилетие, в обзорной литературе не затронута. В настоящем обзоре обобщены новые данные по получению, свойствам и превращениям амидиновых систем различного типа, причем особое внимание удалено применению амидинов в синтезе гетероциклических соединений.

II. МЕТОДЫ СИНТЕЗА

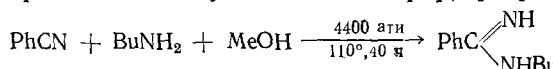
В рассматриваемый период опубликовано весьма значительное количество исследований, касающихся получения различных амидинов. Традиционными исходными соединениями являются нитрилы, которые трансформируют в амидины через промежуточные иминоэфиры. Последние получают обычно воздействием хлористого водорода в спирте и далее вводят в реакции с различными аминами [8—11]. Другой путь основан на алкилировании нитрилов фторборатом триэтилоксония (I) с последующей обработкой борфторидов нитрилиевых солей (II) аминами [12, 13]. Модификацией этого метода является получение нитрилиевых солей с помощью метилового эфира фторсульфоновой кислоты [14].



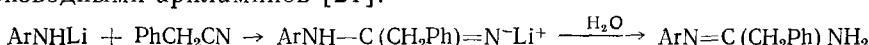
Общим методом синтеза различных амидинов является реакция нитрилов с кислотами Льюиса (обычно используются FeCl_3 или AlCl_3) [15—19] с последующей обработкой полученных комплексов аминами.



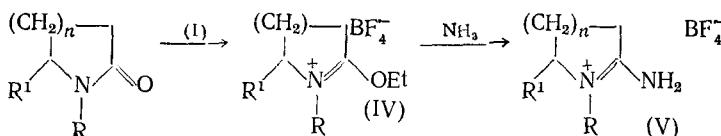
Как видно из приведенной схемы, комплексы нитрилов с хлорным железом (III) могут подвергаться алкилированию галогеналкилами с образованием соответствующих N-замещенных нитрилиевых солей, которые далее удается превратить в N,N,N'-тризамещенные амидины. Своеобразный метод получения амидинов при высоком давлении основан на реакции нитрилов со спиртами и аминами (процесс протекает, по-видимому, через соответствующий иминоэфир) [20].



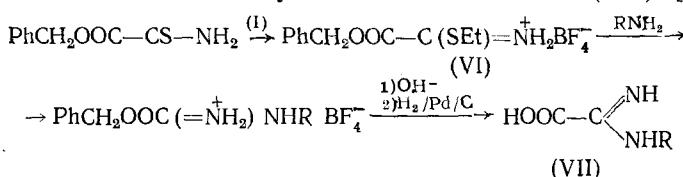
Нитрилы способны также вступать во взаимодействие с литиевыми производными ариламинов [21].



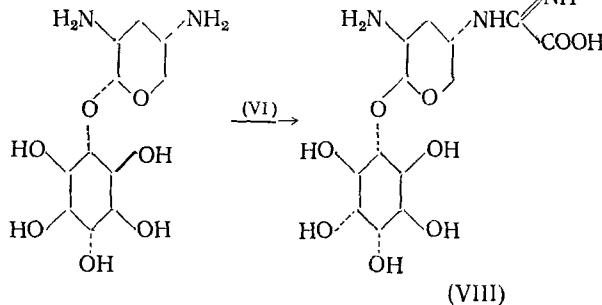
Синтез амидинов из амидов и тиоамидов основан на предварительной активации амидной функции. В многочисленных обзорных работах [22—27], касающихся такой активации, описано, в частности, и значительное число амидиновых синтезов. Указанная активация достигается обычно алкилированием амидов фторборатом триэтилоксония (I) (или диметилсульфатом) [12, 28—30] или ацилированием такими реагентами, как гексаметилфосфортриамид [31, 32], хлорокись фосфора [33—35], пятиокись фосфора [36] и ацилхлориды [37]. Так, при взаимодействии лактамов с I [28] образуются борфториды (IV), которые затем легко вступают в реакцию с аммиаком с образованием амидиневых солей (V). Интересно отметить, что алкилирование пирролидона-2, имеющего в положении 5 карбамидную группу (IV) ($R=Me$, $R'=CONH_2$, $n=1$), протекает избирательно по лактамному карбонилу [28]:



При использовании (I) получена соль тиоиминоэфира (VI) — ключевого соединения в методе получения амидинокислот (VII) [29]:

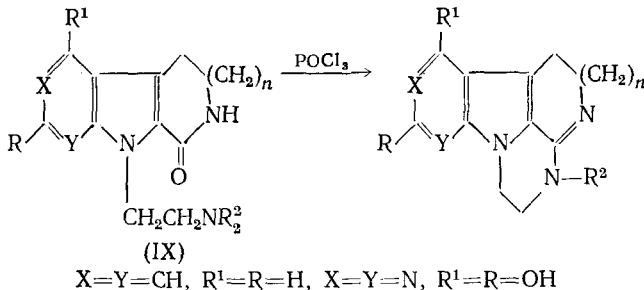


Этот метод был использован в синтезе антибиотика касугатицина (VIII) [29]:

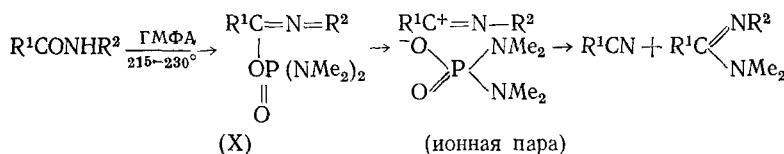


Интересно, что в реакцию с (VI) селективно вступает только экваториальная аминогруппа [29].

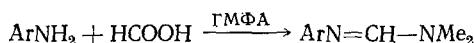
Активация амидной функции трициклических лактамов типа (IX) дала возможность осуществить их циклизацию в тетрациклические индольные системы, содержащие амидиновый фрагмент [33, 35]:



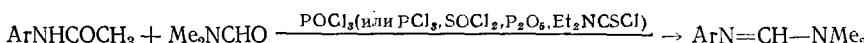
При нагревании амидов с гексаметилфосфортиамидом (ГМФА) образуются нитрилы и амидины через фосфордиамидат-производное (X) [31]:



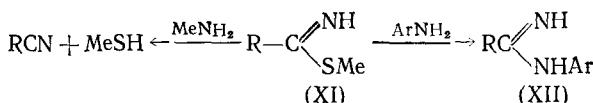
Реакция ароматического амина, муравьиной кислоты и ГМФА дает амины [32]:



Взаимодействие ацетанилидов с диметилформамидом в присутствии POCl_3 , SOCl_2 , PCl_3 [34], P_2O_5 [36] или N,N -диэтилтиокарбамилхлорида [37] приводит к соответствующим амидинам:



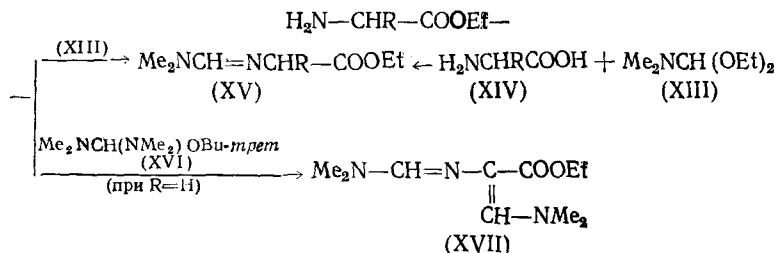
При использовании в амидиновом синтезе тиоиминоэфиров (XI) было установлено, что последние реагируют с ароматическими аминами с образованием амидинов (XII), а с сильноосновными аминами процесс протекает с образованием нитрилов [38]:



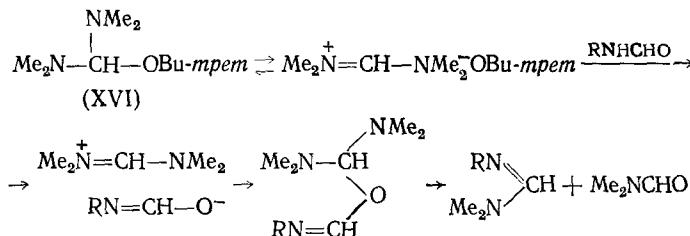
Автору работы [38] удалось найти способ получения амидинов из (XI) даже при использовании алифатических аминов — для этого необходимо проводить реакцию в ацетатном буферном растворе.

Для синтеза амидинов широко используются и другие типы активированных амидов — ацетали амидов и лактамов и родственные соединения, дихлорметилимммониевые соли, соли диэтоксимилиаммония. Большая часть исследований, посвященных амидиновому синтезу на основе этих соединений, подробно освещена в обзорных публикациях [25—27, 39, 40], и здесь будут рассмотрены лишь те работы, которые не вошли в упомянутые обзоры. Ряд работ посвящен синтезу N-гетариламидинов реакцией ацеталей диметилформамида (XIII) и диметил-ацетамида с гетероароматическими аминами. Этим путем получены производные N-пиразинил-2- [41], N-пиридинил-2- [42], N-пиридинил-2- [42], N-пуринил-6- [43], N-пиразолил-3-формамидинов [44] и N-пиразолил-3-ацетамидинов [44]. Реакция (XII) с аминокислотами (XIV) сопровождается алкилированием и в результате образуются амидино-эфиры (XV) [45]. Такого же типа соединения получены при взаимодействии (XIII) с эфирами аминокислот [46]. При использовании в

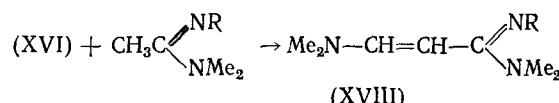
этой реакции более реакционноспособного амиаль-эфира (XVI) образуются енаминоамидины (XVII) [46]:



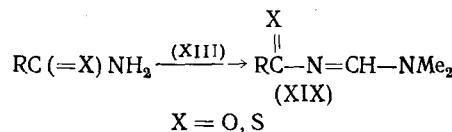
Интересно протекает реакция аминаль-эфира (XVI) с вторичными амидами — в этом случае образуются N,N-дизамещенные амиды и амидины. Авторы предлагают следующий механизм реакции [46]:



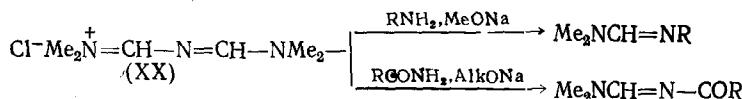
В этой же работе показано, что взаимодействие аминаль-эфира (XVI) с производными ацетамидина приводит к енаминоамидинам (XVIII) [46]:



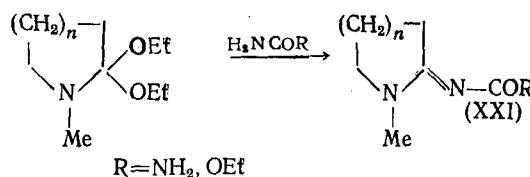
Недавно опубликован ряд исследований, согласно которым ацеталь (XIII) легко вступает во взаимодействие с первичными амидами и тиоамидами, в результате чего образуются ацил- или тиоациламиидины (XIX) — интересные промежуточные продукты в различного рода синтезах [47—49].



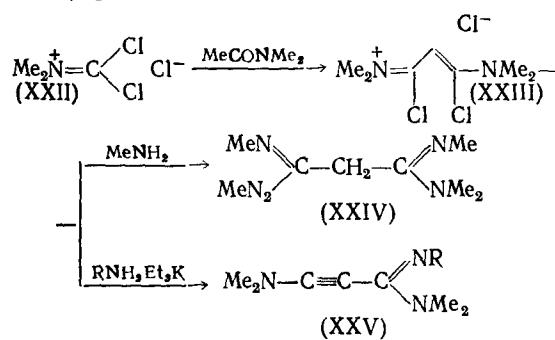
В работе [50] показано, что в синтезе амидинов и ациламидинов вместо ацеталия диметилформамида (XIII) с успехом может быть использована иммониевая соль (XX), полученная ранее [51] при взаимодействии диметилформамида и цианурхлорида:



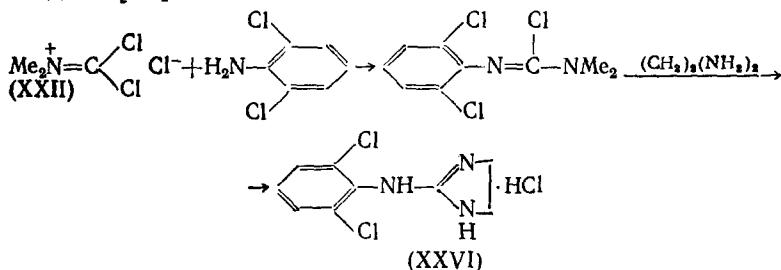
Ацетали амидов и лактамов вступают в реакции с мочевиной и уретаном, образуя соответствующие N-карбомоил- и N-этоксикарбониламидины (XXI) [52]. Отметим, что первые образуют комплексы с одной или несколькими молекулами мочевины:



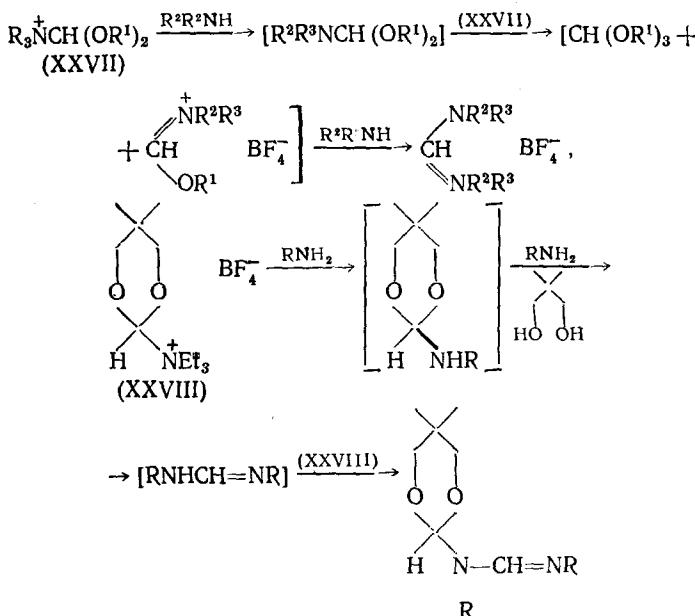
Взаимодействие дихлорметилениммонийхлорида (XXII) с N,N-диметилакетамидом приводит к соли (XXIII), которая в зависимости от условий реакции может быть превращена в диамидины (XXIV) или в инаминоамидины (XXV) [53]:



Недавно опубликован новый синтез ценного лекарственного препарата клофелина (XXVI), основанный на взаимодействии иммонийхлорида (XXII) с 2,6-дихлоранилином с промежуточным образованием хлорформамида [54]:

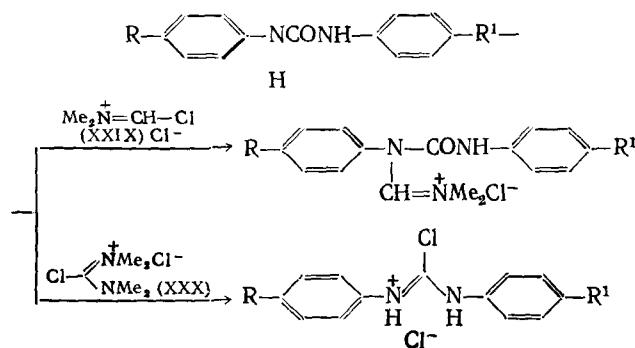


Аналогично из (XXIII) и различных, в том числе и гетероциклических, аминов синтезированы некоторые хлорформамииды [55, 56]. Ряд замещенных формамидинов получен взаимодействием диалкоксиметиламмониевых солей (XXVII), (XXVIII) с алифатическими аминами [57, 58]:

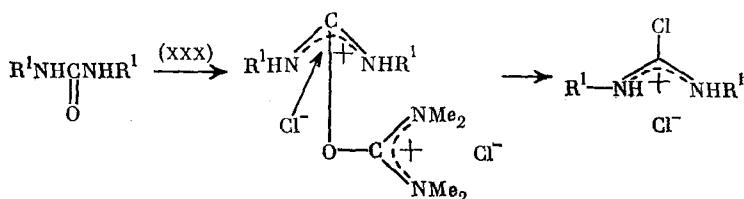


К описанным выше реакциям близко примыкают процессы получения производных формамидина реакцией диарилмочевин с хлоридами хлорметилендиметиламмония (XXIX) и хлордиметиламинометилен-

диметиламмония (XXX) [59]

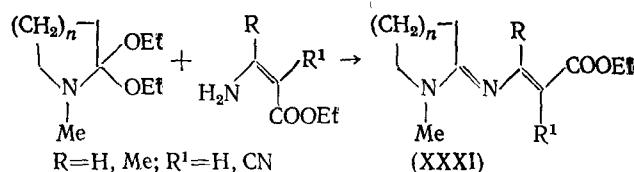


Авторы работы [57] считают, что в первом случае имеет место прямое N-диметиламинометилирование, в то время как во втором случае оно невозможно из-за стерических препятствий и реакция протекает по кислороду с последующей атакой промежуточного катиона хлорид-ионом:

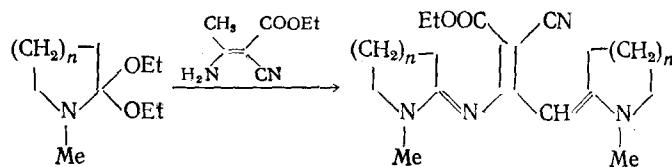


В работе [59] приведен ряд экспериментальных доказательств указанных соображений.

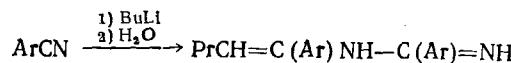
Ацетали амидов и лактамов были использованы также в синтезе интересного класса органических соединений — енамидинов, которые были в ряде случаев использованы для синтеза конденсированных гетероциклов (см. ниже). Енамииды (XXXI) легко и с высокими выходами образуются при реакции амид- и лактамацеталей с первичными енамиинами [60, 61], даже такими малоосновными, как аминометиленциануксусный эфир:



Интересно отметить, что при взаимодействии амид- и лактам- ацеталей с α -циано- β -аминокротоновым эфиром реакция протекает не только по амино-, но и по β -метильной группе [61]:

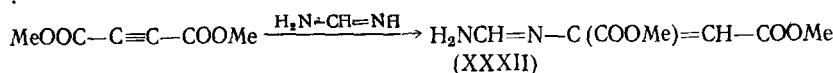


Енамииды были синтезированы также [60, 61] взаимодействием арилцианидов с бутиллитием или магнийорганическими соединениями [62, 63]:

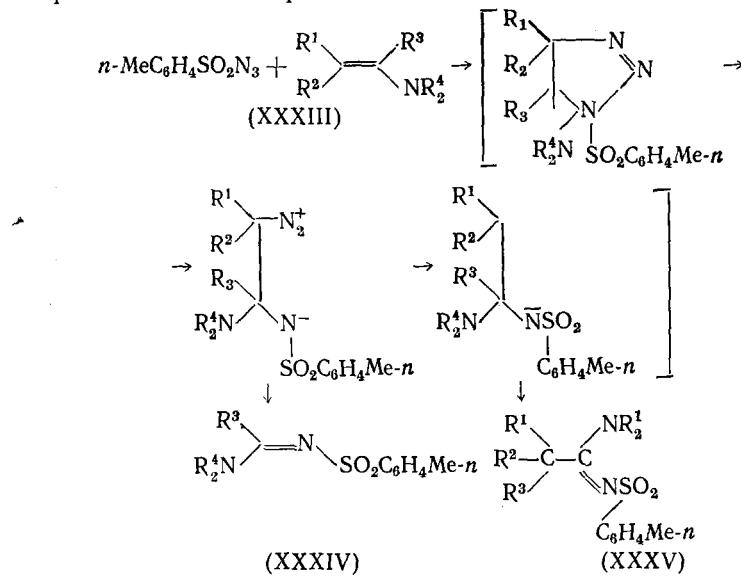


В качестве побочных продуктов в этой реакции образуются замещенные сим-триазины [63]. Еще одно упоминание о синтезе енамидина

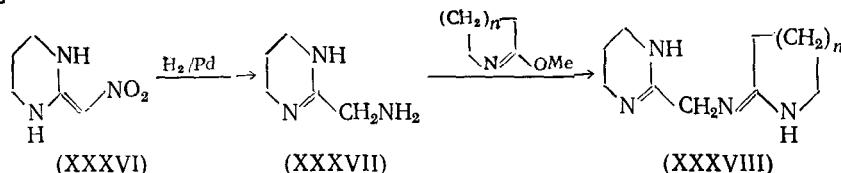
(XXXII) имеется в работе [64] — он получен взаимодействием диметилового эфира ацетилендикарбоновой кислоты с формамидином при -10° :



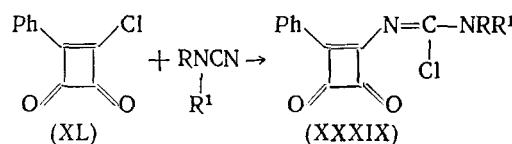
Весьма интересно протекает реакция енаминов (XXXIII) с *n*-толуолсульфонилазидом — в этом случае образуется смесь амидинов (XXXIV), (XXXV) [65]. Отмечено, что когда R^1 и R^2 — алкилы (а не атомы водорода), количество перегруппированных амидинов (XXXV) возрастает, вероятно, из-за способности алкильных групп стабилизировать карбкатионный центр.



Амидины (в том числе циклические амидины) могут быть получены при гидрировании нитроендиаминов (XXXVI). На основе образующихся аминометиламидинов (XXXVII) синтезированы *бис*-амидины (XXXVIII) [66]:

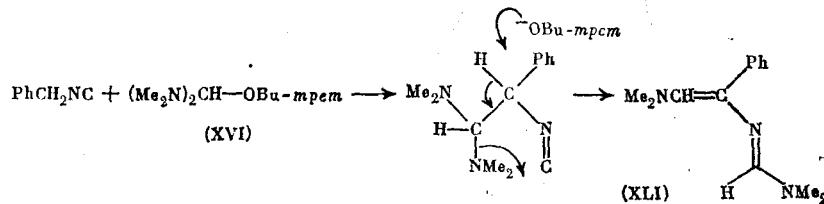


Восстановление карбодиимидов боргидридом натрия [67] или производных мочевины алюмогидридом лития [68] приводит к производным формамидина. На основе производных мочевины и тиомочевины удается синтезировать различные формамииды. Так, хлорформамииды образуются при взаимодействии *N*-гетарил-*N,N'*-диалкилмочевин с Ph_3P и CCl_4 [69] или хлорированием *N,N'*-*бис*(арилсульфонил)-*S*-метилизотиомочевин [70]. Хлорформамидин (XXXIX) образуется также при реакции галоидциклогексиона (XL) с цианамидаами [71]:

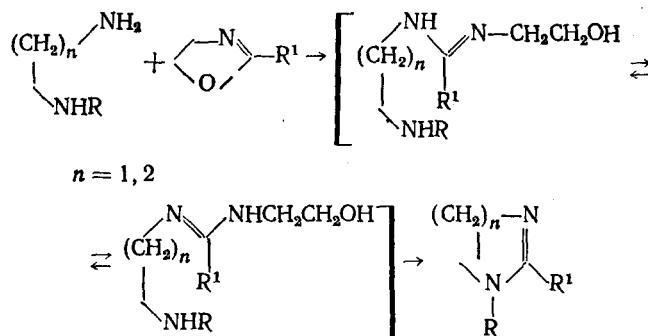


N-Оксиамидины получены реакцией хлоримидов с гидроксиламином [72, 73] или взаимодействием замещенных гидроксимоилхлоридов с аминами [74]. Весьма часто для синтеза амидинов используют реакции изонитрилов с сульфамидаами [75], аминами [76—78], аминаль-эфирам

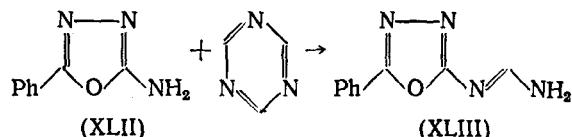
[46]. Следует отметить, что в работах [76, 77] показано, что реакция присоединения вторичных аминов к изонитрилам протекает стереоспецифично с образованием *Z*-форм амидинов, которые затем перегруппировываются в термодинамически более стабильные *E*-изомеры. Взаимодействие аминаль-эфира (XVI) с бензилизоцианидом протекает по метиленовому звену с последующей перегруппировкой [46] с образованием амидина (XL1):



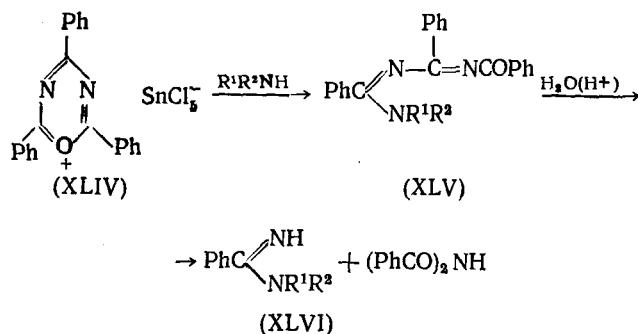
Ряд работ посвящен получению амидинов с участием в соответствующих реакциях некоторых гетероциклических агентов. Так, взаимодействие производных этилен- и пропилендиамина с Δ^2 -1,3-оксазолином приводит к циклическим амидинам [79]:



Реакция 2-амино-5-фенил-1,3,4-оксадиазола (XLII) с *симм*-триазином приводит к производному формамидина (XLIII) [80]:

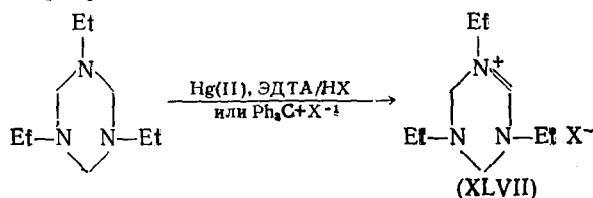


При взаимодействии солей 1,3,5-оксадиазиния (XLIV) с аминами образуются N (N-бензоилимино)бензиламидины (XLV), которые в кислой среде гидролизуются доベンзамидинов (XLVI) и дубензоиламина [81]:

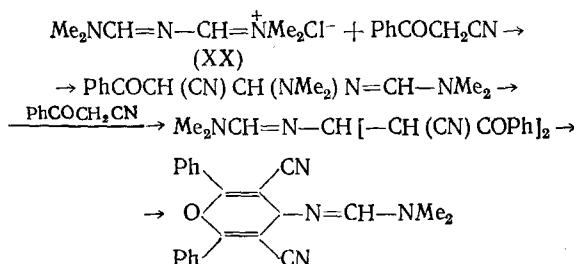


Циклические амидиниевые соли (XLVII) удается получить при окислении N,N',N"-триэтилгексагидротриазина или при обработке этого соединения

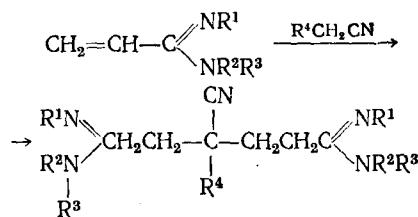
нения $\text{Ph}_3\text{C}^+\text{X}^-$ [82]:



Недавно было показано [83], что иммониевая соль (ХХ) может быть использована для введения формамидинового фрагмента в соединения, имеющие активное метиленовое звено:

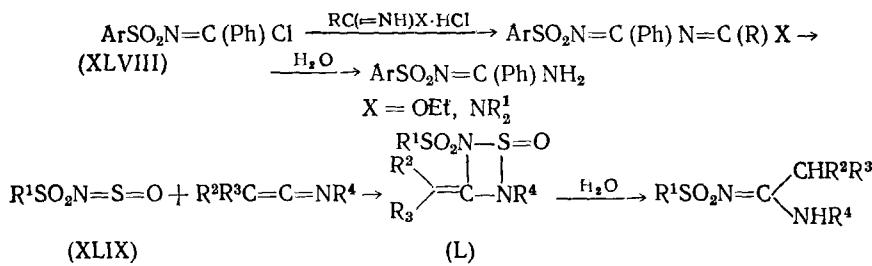


В последние годы было установлено, что амидиниевая группа может быть введена в различные органические соединения (амины, спирты, соединения с активным метиленовым звеном, меркаптаны) путем реакции амидиноэтилирования, протекающей по типу реакции Михаэля [84—87], например:

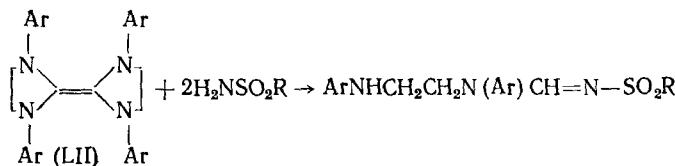


Производные формамидина и гомологичных амидинов образуются при реакции амидов щелочных металлов с альдегидами в жидким аммиаке [88], а N,N' -диметилформамидин получен при термическом разложении метиламида калия [89].

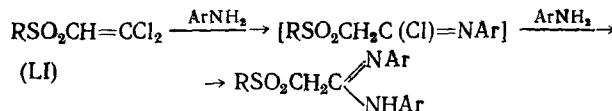
Ряд исследований посвящен синтезу амидинов, имеющих серу, фосфор- и кремнийсодержащие заместители при атомах азота⁴. Так, сульфониламидины синтезированы взаимодействием арилсульфонилхлоримидов (XLVIII) с гидрохлоридами иминоэфиров (или амидинов) с последующим гидролизом промежуточных имидоэфиров или имидоиламидинов [90], реакцией N-сульфинилсульфонамидов (XLIX) с кетениминами, протекающей через [2+2]-циклоаддукты (L) [91] и взаимодействием сульфонамидов с енитетрамином (LI) [92]:



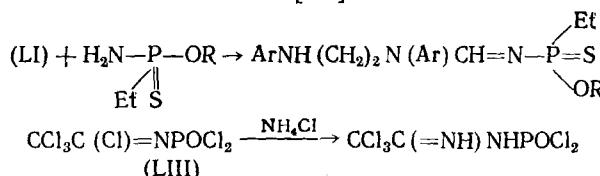
¹ См. также работу [65], стр. 675 настоящего обзора, которая вынесена в раздел, связанный с получением амидинов на основе енаминовых соединений.



Реакция дихлорвинилсульфонов (LII) с ароматическими аминами про- текает через промежуточное образование хлоримидов [93]

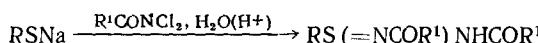


Фосфорсодержащие амидины синтезированы при фосфорилировании ен-тетрамина (LI) [92], а также реакцией хлоримида (LIII) или родствен-ных соединений с солями аммония [94]:

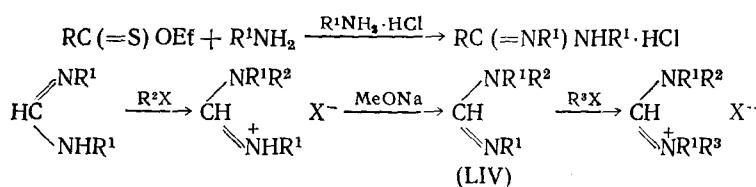


Кроме того, синтез такого типа соединений может быть осуществлен на основе реакций N-незамещенных амидинов с галоидными соединениями фосфора [95, 96]. Аналогично взаимодействием амидинов с триметилхлорсиланом получены N-триметилсиламины [97], которые также образуются при взаимодействии триметилсиламина с бутиллитием с последующей обработкой Li-производного хлоримидами [97].

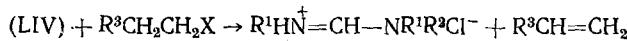
Интересный класс соединений — сульфаниамиды синтезирован реакцией N,N-дихлормочевины [98], N,N-дихлорамидов [99] или N,N-дихлорамидов дифеноксифосфорной кислоты [100] с тиолятами натрия:



И в заключение этого раздела укажем на два новых синтеза амидинов, первый из которых основан на реакции О-этилтиоэфиров с аминами в присутствии их гидрохлоридов [101], а второй — на алкилировании ди- и тризамещенных амидинов [102]:



Интересно, что, когда тризамещенные амины (LIV) алкилируют малореакционноспособными галоидалкилами параллельно алкилированию может иметь место отрыв от последних элементов галогенкислот с образованием соответствующих амидиниевых солей [101]:

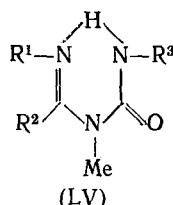


III. СТРОЕНИЕ И ФИЗИКО-ХИМИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

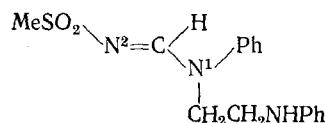
При рассмотрении строения амидинов следует учитывать возможность прототропной «амидиновой» тautомерии, обусловленной переносом протона от одного атома азота к другому. В целом ряде случаев однако, физико-химическими методами удается обнаружить только одну из тautомерных форм. Так, для ряда циклических амидинов — производных 2-амино- Δ^4 -пирролинов и 2-амино- Δ^4 -пиперидеинов, с помощью ИК-спектров установлено, что эти соединения существуют в амино-фор-

ме [103]. При наличии у одного из атомов азота электроноакцепторного заместителя обычно доминирует тот таутомер, в котором C=N-связь сопряжена с этим заместителем [75, 95].

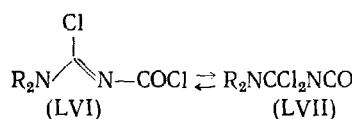
Применение ИК-спектров для изучения структуры N-карбамоиламидинов (LV) дало возможность наблюдать для этих соединений сильную внутримолекулярную Н-связь [104]:



ИК-спектры оказались весьма полезными и для изучения водородных связей амидинов с растворителем. Так, было установлено, что производные формамидина образуют с хлороформом комплексы двух видов: с участием, как иминного, так и аминного атомов азота [105], в то время как в циклических амидинах [103] водородная связь с CHCl_3 , образуется только за счет циклического азота. ИК-спектры использованы также для выяснения характера координации в борамидинах [106]. Значительное внимание исследователей привлекла проблема взаимного расположения заместителей относительно связи $\text{C}=\text{N}$ в амидинах. В работах [107, 108] методом ПМР-спектроскопии изучена *син-анти-изомеризация* в амидинах различного типа. При изучении присоединения вторичных аминов к изонитрилам [76, 77] авторы пришли к выводу, что сначала образуются *Z*-формамиидины, которые термодинамически нестабильны и перегруппировываются затем в *E*-изомеры². Напротив, в работе [92] указывается на выделение стабильных *Z*- и *E*-изомерных *N*-сульфониламидинов. Однако впоследствии, при подробном исследовании их структуры методами ИК-, ПМР- и ЯМР¹³С-спектроскопии было установлено, что выделенные вещества являются ротамерами относительно $\text{C}=\text{N}'$ -связи [110].

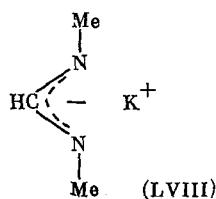


Интересные данные получены [111] при изучении структуры N-хлоркарбонилхлорформамидинов (LVI) — установлено, что они находятся в равновесии с соответствующими N,N-диалкиламино-1,1-дихлорметилизоцианатами (LVII):



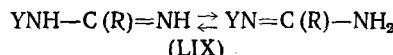
Серия работ посвящена изучению заторможенного вращения относительно C=N-связи в амидинах методом спектроскопии ПМР [108, 112–117]. Свободные энергии активации процесса (ΔG^\ddagger) обычно не слишком высоки и в зависимости от структуры амидина варьируют в пределах 11–21 ккал/моль, причем для солей амидиния величины ΔG^\ddagger заметно выше [108]. Интересно, что для K-соли амидина (LVIII) обнаружить явление заторможенного вращения относительно связи C=N не удалось [112].

² Отнесение амидинов к Z- или E-ряду может быть осуществлено и на основании спектров ЯМР ^{13}C [109].

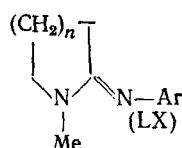


Отметим, что в этой же работе методом спектроскопии ПМР изучена «амидиновая» таутомерия и получены термодинамические параметры таутомерного равновесия [112].

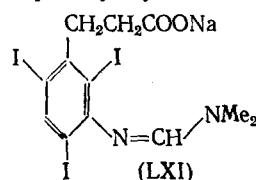
Количественная оценка тautомерного равновесия проведена с помощью УФ-спектров и сопоставления констант ионизации некоторых амидинов и модельных соединений [118, 119]. При этом показано, что для амидинов (LIX):



где Y — электроноакцепторный заместитель, равновесие существенно сдвинуто вправо и для Y -ацил $K_t \approx 30$, а при $Y=SO_2R$ $K_t \sim 10^7$ [118]. Если Y — замещенный фенил, равновесие сдвинуто уже не так существенно и $K_t=2,4$ [119]. В работах [120—122] измерены константы ионизации ряда циклических амидинов и показано, что величины pK_a существенно зависят от величины цикла³, причем основность падает в ряду $C_6 > C_7 > C_8 \approx C_5$ [122]. Авторы объясняют это явление конформационными факторами — для шестичленного цикла возможна плоскостная конфигурация амидинового фрагмента, которая для 5-, 7- и 8-членных соединений энергетически невыгодна из-за несвязанных взаимодействий протонов циклических метиленовых групп [122]. Изучение констант ионизации ряда амидинов и корреляции величин pK_a с σ -константами [124, 125] привели авторов к заключению, что величины ρ и вообще основность амидинов больше зависит от заместителей при иминном, чем при аминном атоме азота. Исследование протонирования 2-арилимино-1-азациклоалканов (LX) показало [126], что оно протекает по эндоциклическому, иминному атому азота.



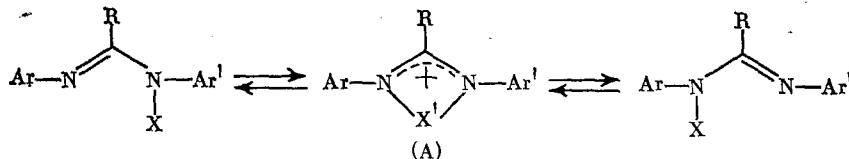
Амидины (LX) — весьма сильные основания (pK_a 6,5—9,6), основность которых также зависит от величины цикла [123, 126]. На основании корреляционного анализа — сопоставления величин pK_a с σ - и σ^+ -константами в этих работах установлено, что арильное кольцо повернуто относительно $C=N$ -связи примерно на 50—60°. Такой же поворот гетарильного остатка имеет место, по-видимому, и в производных N -(пиразолил-3)-амидинов [44]. Высокая основность амидинов используется в аналитической химии для их количественного анализа — одним из методов анализа ⁴ рентгеноконтрастного препарата билимина (LXI) является его титрование $HClO_4$ в среде уксусной кислоты [127].



³ Обзор по зависимости свойств органических соединений от величины цикла см. [123].

Вообще, количественный анализ амидинов, по-видимому, наиболее целесообразно проводить титрованием их, как монокислотных оснований. Недавно появилась работа [128], согласно которой анализ некоторых амидинов можно проводить методом ГЖХ.

Как уже указывалось, «амидиновая» таутомерия обусловлена переносом протона от одного атома азота триады к другому. К таутомерии этого типа близко примыкает процесс 1,3-переноса различных группировок внутри амидиновой системы, изученный методом динамической спектроскопии ПМР [134—138] и путем квантово-химических расчетов [139]:



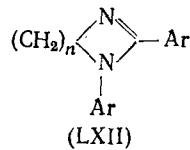
Этот обратимый процесс исследовался для различных заместителей (X =ацил [134, 138], 2,4-динитрофенил и пикрил [135, 138] и сульфенильный остаток [136, 137]). В специальных опытах [134] установлено, что процесс 1,3-переноса является внутримолекулярным.

Энергетические характеристики процесса зависят от структуры X , а также от строения заместителей R , Ar и Ar' . Существенно, что для X -ацил энтропия активации (ΔS^*) — небольшая положительная величина, так что в этих случаях (A) — не переходное состояние, а интермедиат. В то же время, когда $X=SR^t$, величина $\Delta S^*=-14\div-24$ э. е., так что переходное состояние более упорядочено, чем исходное, что согласуется со структурой типа (A). При изучении ПМР-спектров ацил- и сульфениламидинов при низких температурах авторы работ [134, 136] наблюдали процессы заторможенного вращения относительно связей $N-CO$ и $N-S$ соответственно.

IV. ХИМИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

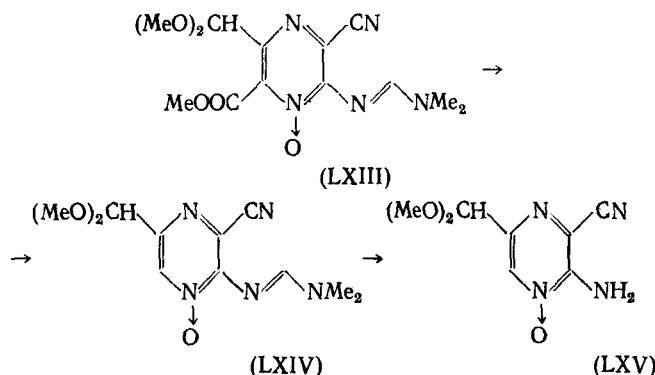
1. Реакции с нуклеофильными и электрофильными реагентами

Наиболее простой реакцией амидинов (или их солей) с нуклеофильными реагентами является их гидролиз. Механизм гидролиза амидинов подробно обсужден в монографии [1] и новые исследования [121, 122, 140] не вносят существенных изменений в уже имеющиеся представления. Рассмотрение вопроса о влиянии на скорость щелочного гидролиза циклических амидинов (LXII) величины цикла [122, 123] позволило авторам установить следующий порядок уменьшения константы скорости: $C_5 > C_6 > C_7 > C_8$ [122].

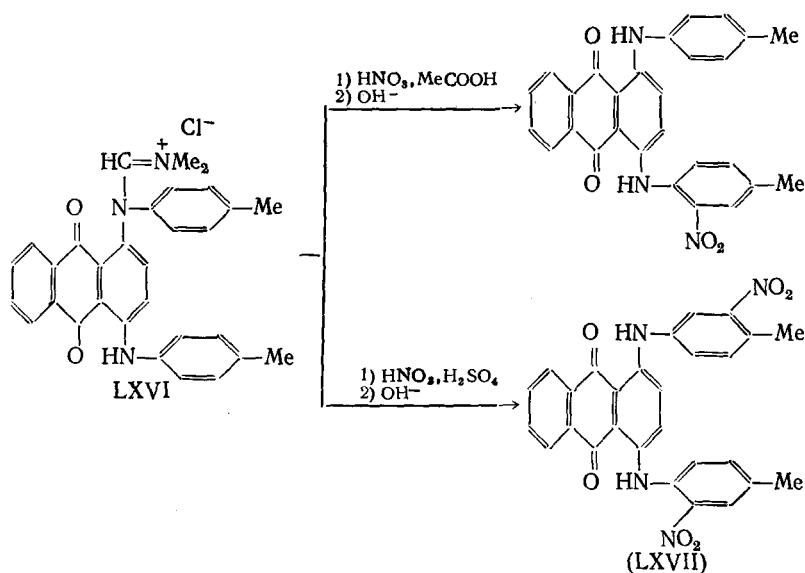


Наибольшую скорость расщепления (LXII) ($n=2$) авторы приписали напряженности пятичленного кольца, а малая скорость гидролиза семи- и восьмичленных амидинов вызвана, по их мнению, стерическими препятствиями при атаке гидроксил-аниона этих циклов [122]. Сопоставление скоростей кислого и щелочного гидролиза для N,N' -диметилформамидина показало, что в щелочной среде процесс протекает существенно быстрее. Недавно опубликовано интересное исследование [41], касающееся условий сохранения и расщепления амидиновой группировки при гидролизе, в зависимости от поставленных синтетических задач. Так, для замещенного пиразина (LXIII) удалось избирательно омыть (а затем и декарбоксилировать) метоксикарбонильную группу, не затронув амидиновую, путем кипячения раствора этого соединения во влажном пиридине в присутствии иодистого лития. На следующей стадии, напротив, потребовалось избирательно удалить формамидиновую группировку, не затрагивая ацетальную. Обычный метод — обработка водным ам-

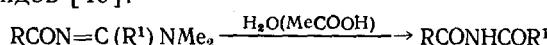
миаком оказался неприемлемым, так как при этом наблюдалось замыкание пиридинового цикла; использование кислотного гидролиза в водном растворе также было невозможно из-за разрушения ацетальной защиты:



Авторы работы [41] нашли неожиданное решение и получили аминопроизводное (LXV) путем выдержки формамидина (LXIV) в смеси MeOH—CH(OMe), (1:1) в присутствии $TsOH \cdot H_2O$. В рассмотренном выше случае трансформация группы NH_2 в формамидиновую была проведена для защиты амино-группы. Подобного рода защита позволила решить задачу получения мононитро- (или монобром- и моно-N-ацил-) производных антрахинона (LXVI) [141—143]:

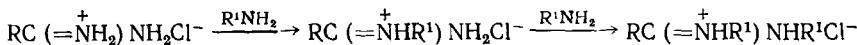


Применение амидиниевой защиты с последующим ее гидролизом позволило синтезировать весьма труднодоступные другими методами производные типа (LXVII), имеющие *o*- и *m*-заместители в симметричных арильных заместителях в 1,4-положениях антрахинонового цикла [141]. Гидролиз амидинового фрагмента явился заключительной стадией в новом синтезе имидов [49]:

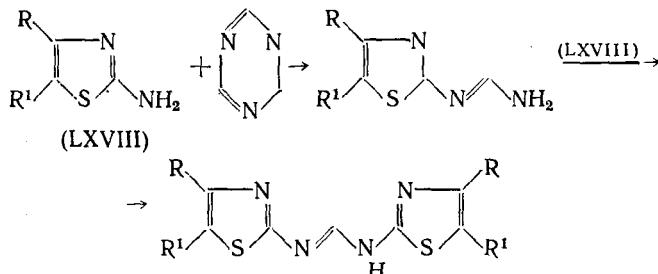


Обсуждение рассматриваемых исследований следует закончить указанием на то, что гидролиз циклических амидинов является модельной реакцией для изучения ферментативного переноса одноуглеродных компонентов [144, 145]. Обзор по этому вопросу см. [146]. Одной из весьма важных реакций амидинов или их солей с нуклеофильными реагентами, которая применяется как один из этапов гетероциклического синтеза (см. ниже), является реакция переаминирования. Недавно с использо-

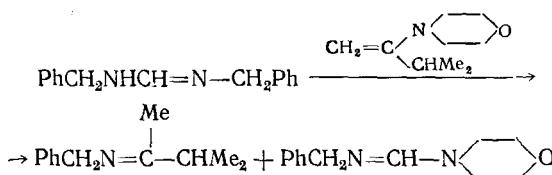
ванием этой реакции описан синтез N,N'-дизамещенных амидинов [147]



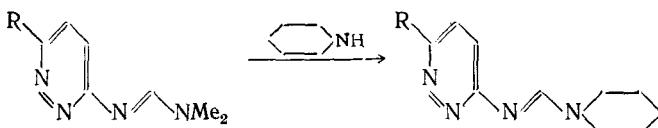
Взаимодействие гетероциклических аминов (например, (LXVIII)) с *симм*-триазином также сопровождается переаминированием [148]:



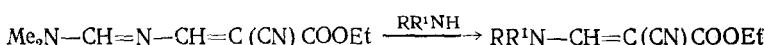
Весьма интересно протекает реакция амидинов с третичными енамина-ми — конечным результатом и здесь является переаминирование [149]:



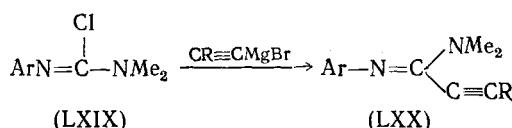
Вторичные амины при нагревании также способны вступать в реакции этого типа [150]:



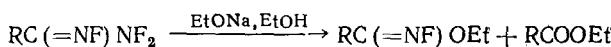
Исследование свойств N-антрахинонилформамидинов показало, что они реагируют с нуклеофильными реагентами только в протонированной форме [151]. При изучении переаминирования в ряду енамидинов было установлено, что реакция протекает не по амидиновому *мезо*-углеродному атому, а по енаминовому α -положению с образованием енаминов (а не пиримидинов, как можно было ожидать) [152]:



Замещенные хлорформамидины легко реагируют с нуклеофильными реагентами, образуя различного типа гуанидины [55, 56, 71], производные мочевины [70], О-алкилизомочевины [154]. Взаимодействие амидинов (LXIX) с этинилмагний бромидом приводит к амидинам пропиоловой кислоты (LXX) [155]:

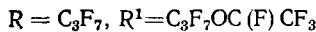
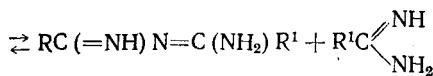
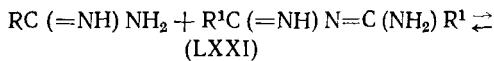


N,N,N'-Трифторамиидины при обработке алкоголятом натрия при низких температурах дают смесь N-фториминоэфиров и сложных эфиров [156]:

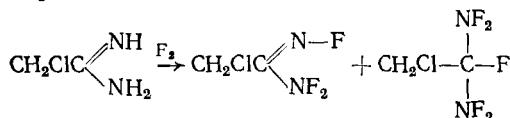


При взаимодействии амидинов с достаточно сильными С-кислотами образуются соли [157]. Реакция имеет первый порядок по обоим компонентам. Однако, когда вместо С-кислоты в реакцию вступает ее дитероаналог, наблюдается сложная кинетика, вызванная многочисленными процессами изотопного обмена [157]. Методом ЯМР¹⁹F изучены обмен-

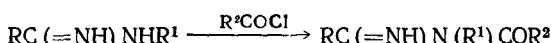
ные реакции с участием имидоиламидинов (LXXI) [158, 159], например:



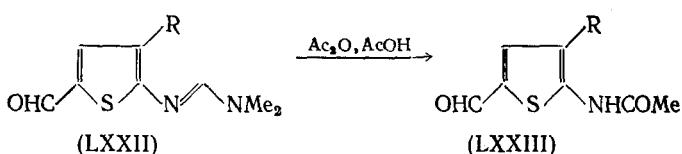
Из реакций амидинов с электрофильными реагентами, изученных в последние годы, отметим, в первую очередь, фторирование, протекающее, в основном, с образованием N,N,N'-трифторпроизводных [160], хотя в некоторых случаях выделены и продукты присоединения фтора по C=N-связи [160]:



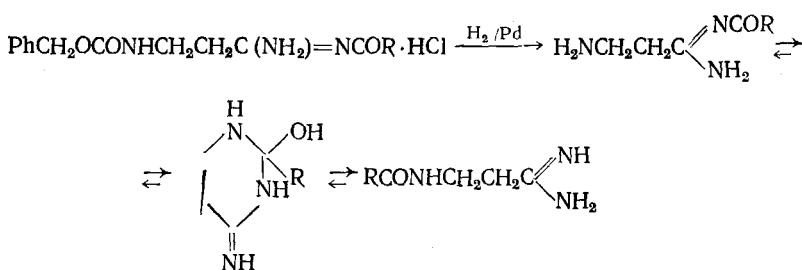
Ряд исследований посвящен ацилированию амидинов. N-Монозамещенные амидины ацилируются ацилхлоридами по замещенному атому азота [161]:



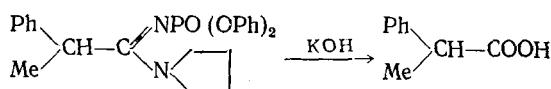
При ацилировании N-гетарил-N,N'-диметилформамидинов (LXII) образуются соответствующие ациламиды (LXXXIII) [42, 162], например:



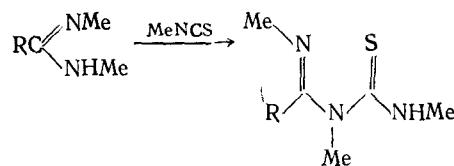
Для соединений, имеющих одновременно амино- и амидиновую группы, изучена реакция ацилирования и разработан аналитический метод, позволяющий определить положение ацильной группировки [163]. Весьма интересно наблюдение авторов [163] о переносе ацильной группы в ациламиноамидинах:



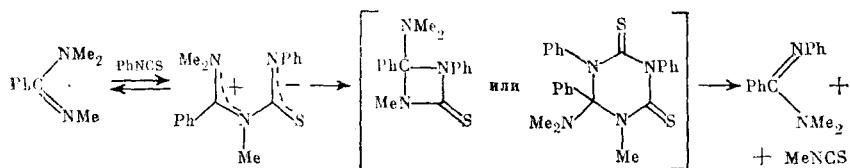
При ацилировании ацилхлоридами N-дихлорфосфониламидинов реакция протекает по незамещенному атому азота [94]. Взаимодействием амидинов с триэтилфосфитом [164] и пятихлористым фосфором [165, 166] также синтезированы соединения, замещенные по N-атому группами $\text{PO}(\text{OEt})_2$, PCl_3 , PCl_4 . Амидины, замещенные по азоту остатком фосфорной кислоты, явились исходными соединениями в новом синтезе замещенных уксусных кислот [167]:



При взаимодействии амидинов с алкилизотиоцианатами образуются N-тиокарбамидоамидины [168, 169]:

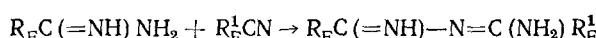


Напротив, при взаимодействии N,N,N'-тризамещенных амидинов с арилизотиоцианатами протекает обменная реакция [170]:



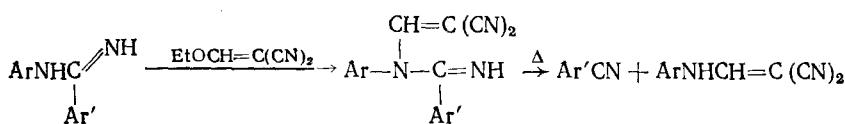
Предположение о значительных стерических требованиях переходного состояния подтверждается высоким отрицательным значением энтропии активации ($-36,1$ э.е.) [170].

К указанным выше работам близко примыкает исследование синтеза фторированных имидоиламидинов реакцией амидинов с нитрилами [171]:

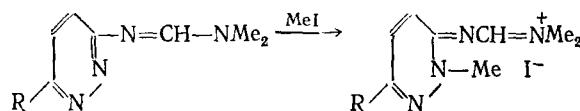


R_F и R_F^1 — фторированные радикалы. Следует отметить, что эта реакция весьма чувствительна к стерическому фактору и при увеличении объема R_F^1 скорость процесса резко снижается [171].

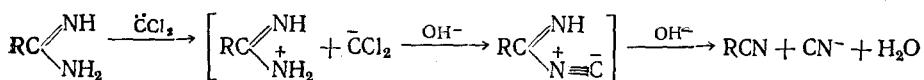
В немногочисленных исследованиях, посвященных алкилированию амидинов, имеющих NH-группу показано, что реакция протекает обычно достаточно гладко. Это наблюдается при взаимодействии амидинов с эфиром пропиоловой кислоты [172], галоидными алкилами [173] (в последнем случае использовались также Li-соли амидинов) и при реакции с этоксиметиленмалононитрилом [172, 174]. Отметим, что образующиеся при этом енамидины при нагревании расщепляются на енамины и нитрилы [174]:



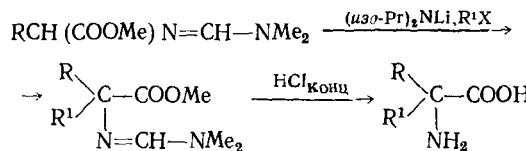
Интересно протекает алкилирование N-(пиридинил-3)-N',N'-диметилформамидина иодистым метилом — центром алкилирования в этом случае является N²-атом цикла [150]:



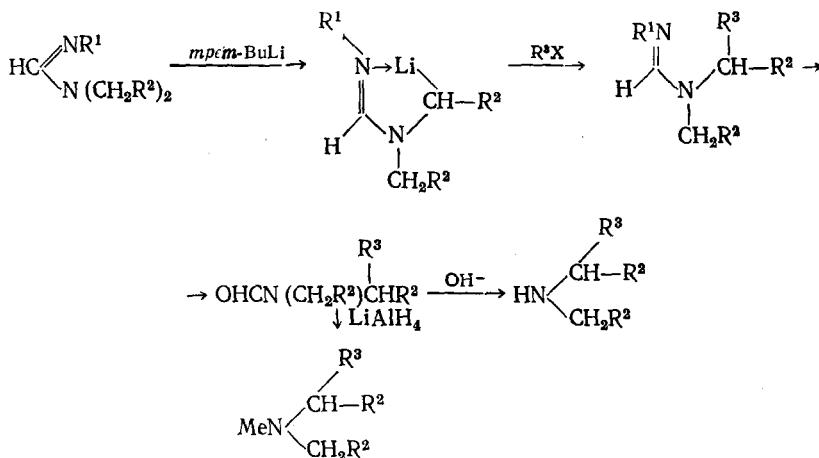
Дихлоркарбен также атакует амидины по незамещенному атому азота — конечным результатом процесса (который протекает в условиях межфазного катализа) является нитрил и цианид-анион [175]:



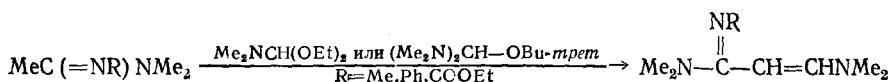
Недавно опубликован новый метод синтеза α -замещенных аминокислот, основанный на алкилировании N,N,N' -тризамещенных амидинов [45]:



На аналогичном принципе основан также новый метод получения α -замещенных аминов [176]:



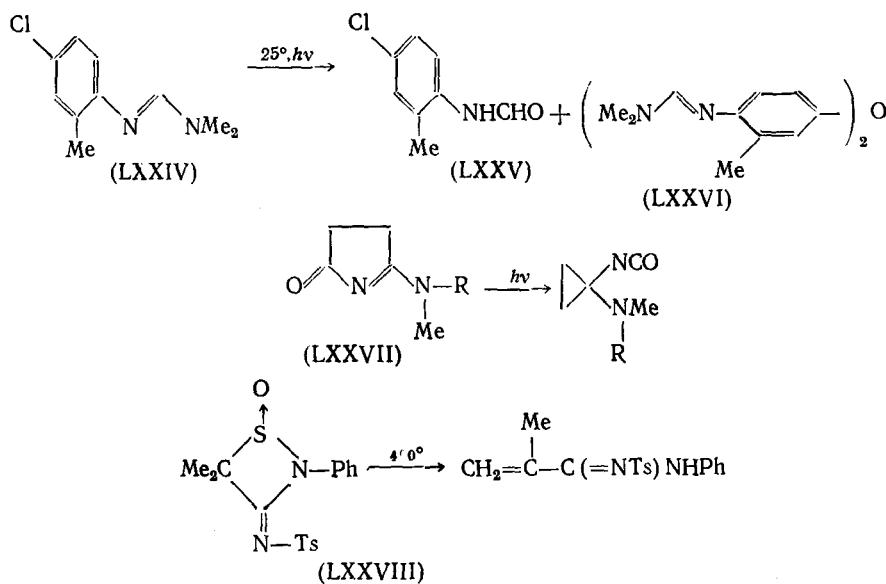
В рассмотренных выше работах, касающихся реакций амидинов с электрофильными реагентами процесс протекал либо по атому азота, либо по углеродному атому алкильной группы, находящейся при N-атоме. Возможность замещения протонов метильной (метиленовой) группы, находящейся при амидиновом мезоуглеродном атоме⁵ вытекает из сопоставления электроноакцепторного влияния иминоэфирной и амидиновой функций [177]. Способность амидинов (типа (LX), стр. 680) к реакциям с электрофильными реагентами по α - $\text{CH}_3(\text{CH}_2)$ -группировкам была впервые продемонстрирована на примере реакции дейтерообмена [177]. Было установлено, что соединения (LX) в мягких условиях (CD_3OD , 20°) обменивают α -протоны цикла на дейтероны, причем обмен ускоряется в присутствии кислых и основных катализаторов [177]. Циклические α -протоны енамидинов (XXXI), (стр. 674) также обмениваются на дейтерий, правда в более жестких условиях [60]. Недавно опубликован ряд исследований, показывающих, что ацетали амидов и аминалль-эфиры способны конденсироваться по метильной (метиленовой) группе при амидиновом мезо-углеродном атome [46, 52]:



И в заключение этого раздела обзора укажем на работы по фотолизу N -(*o*-метил-*n*-хлорфенил)- N,N' -диметилформамидина (LXXIV), который в воде при УФ-облучении превращается в соответствующее формил-производное (LXXV) и бис-амидиноэфир (LXXVI) [182], фотохимической перегруппировке циклического амидина (LXXVII) [183] и термо-

⁵ Этот принцип введения заместителей в α - $\text{CH}_3(\text{CH}_2)$ -группу, названный «принципом потенциальной енамиинизации» был использован также при изучении реакций ацеталей амидов и лактамов, а также различных типов енаминов с электрофильными реагентами, причем наиболее эффективным оказалось его применение в гетероциклическом синтезе (см., например, [178–181]).

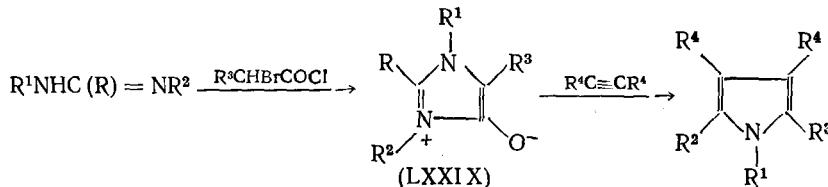
лизу 1-окиси-3-сульфонилимино-1,2-тиазетидина (LXXVIII) [184].



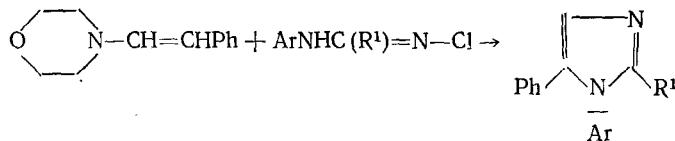
2. Реакции гетероциклизации

Синтез гетероциклов с использованием амидинов основан также на их реакциях с электрофильными или нуклеофильными реагентами. Однако, учитывая важность этой области исследования, мы сочли целесообразным выделить реакции гетероциклизации в отдельный раздел обзора.

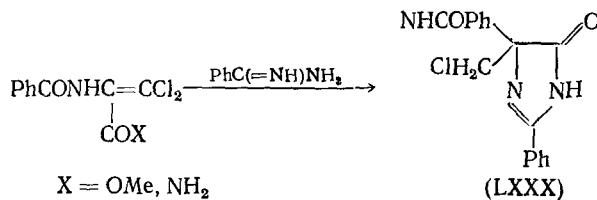
Амидины явились исходными соединениями для получения большой группы пятичленных гетероциклов. Так, взаимодействием N,N-диалкилбензамидинов с дифенилциклогепеноном синтезированы 2-диалкиламино-2,4,5-трифенил-2,3-дигидропирролоны-3 [185]. Ряд работ посвящен получению мезоионных соединений (LXXIX), которые действием ацетиленовых производных превращают в пирролы [186—188]:



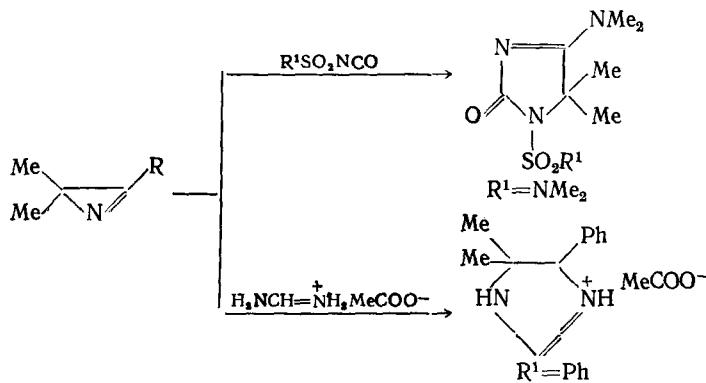
При взаимодействии третичных енаминов с N-хлорамидинами образуются производные имидазола [189—191]:



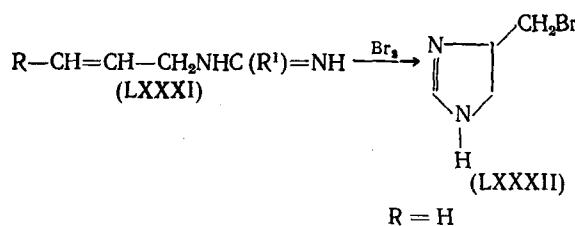
Имидазолоны (LXXX) получены реакцией α -карбамидо- (или этокси-карбонил)- β , β -дихлоренамидов с амидинами [192]:



Производные имидазола синтезированы также на основе замещенных азиринов [193, 194]:

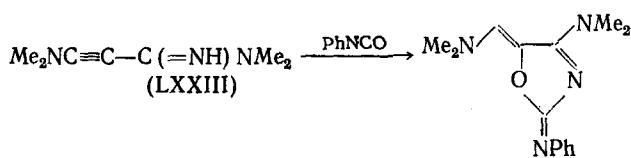


Недавно установлено, что амидины (LXXXI), имеющие ненасыщенную группировку в боковой цепи могут превращаться в имидазолины (LXXXII) [195]:

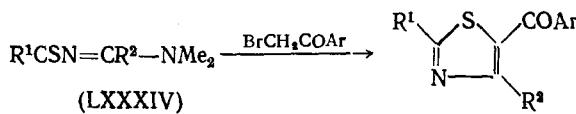


Отметим, что когда в (LXXXI) $R=Ph$, образуются производные тетрагидропirimидина [195].

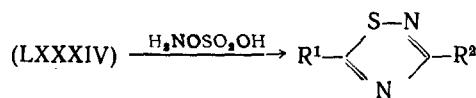
Для синтеза производных оксазола использована реакция инаминоамидинов (LXXXIII) с углекислым газом или фенилизоцианатом [53]:



Удобный в препаративном отношении метод синтеза замещенных тиазолов основан на реакции тиоациламидинов (LXXXIV) с α -бромкетонами [196, 197]:

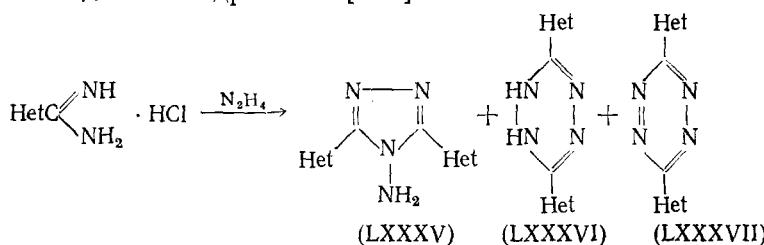


Амидины (LXXXIV) используются также для получения тиадиазолов [48]:



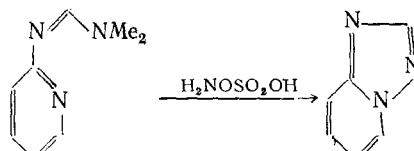
Тот же принцип применен в синтезе производных триазола [47, 52] и оксадиазола [47]: в этих случаях в реакцию с гидразином [47, 52] и гидроксиламином [47] вводились N-ациламидины [47] или N-этокси-карбониламидины [52]. Интересный синтез N-амино-тетразолов (LXXXV) и тетразинов (LXXXVI), (LXXXVII) основан на взаимодействии

вии гетариламидинов с гидразином [198]:

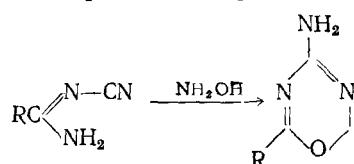


Het — фурил-2, тиенил-2, фурил-3, тиенил-3, сelenофенил-2, сelenофенил-3

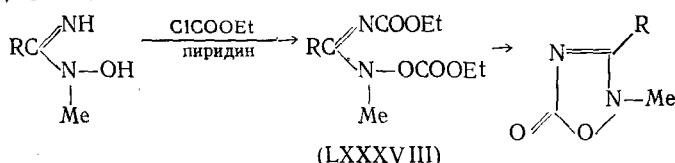
Недавно опубликован новый синтез конденсированных триазолов из N-пиридилил-2- и N-изохинолил-1-формамидинов [199]:



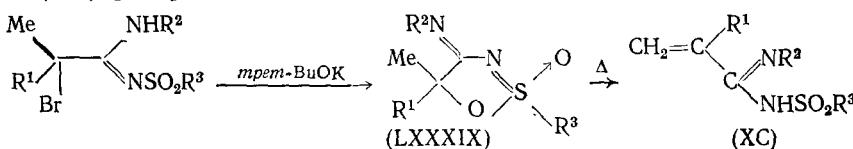
N-Окси- и N-цианамидины использованы в синтезе оксадиазолов [200] — в первом случае амидины вводят в реакцию с бромцианом или трихлоруксусным ангидридом, во втором — с гидроксилимином:



Другой способ получения оксадиазолов из N-оксиамидинов заключается в их взаимодействии с хлоругольным эфиром с последующей внутримолекулярной циклизацией промежуточного O,N-бис-ацилпроизводного (LXXXVIII) [201]:

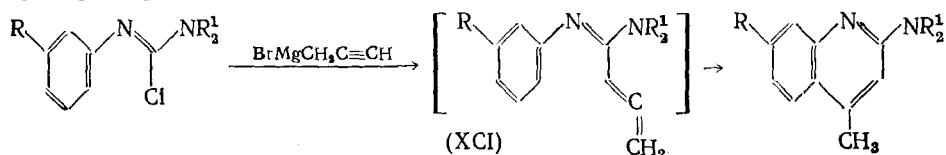


Описано также превращение α -бром-N-сульфониламидинов в оксаизотиазолины (LXXXIX), которые при нагревании изомеризуются в еамидины (XC) [202]:

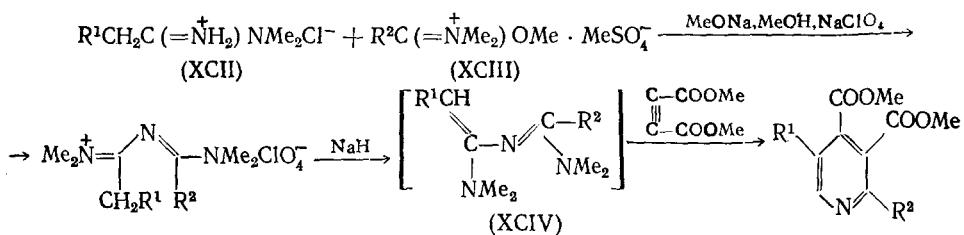


Еще более перспективным является использование амидинов в синтезе различных шестичленных, особенно пиридиновых, пиримидиновых и триазиновых систем.

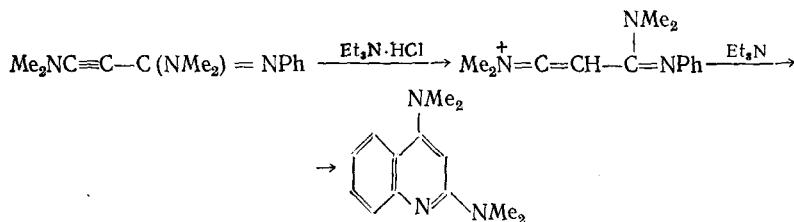
Замыкание пиридинового цикла удалось осуществить при взаимодействии хлорформамидинов с этинилмагнийбромидом или пропаргилмагний бромидом [155]. В последнем случае процесс протекает, по-видимому, через промежуточное образование аллена (XCI):



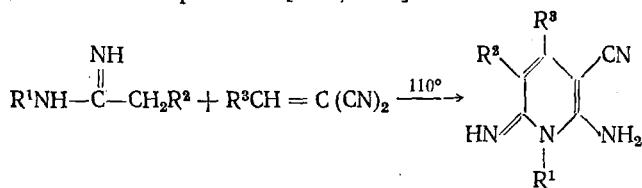
Реакция соли амидина (ХСII) с метилсульфатным комплексом (ХСIII) с последующей обработкой промежуточного енаминоамидина (ХСIV) ацетилендикарбоновым эфирем также приводит к образованию производного пиридина [203]:



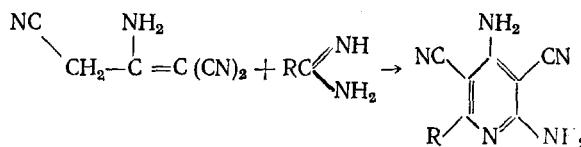
Показано также, что наличие тройной связи в заместителе при мезоуглеродном атоме амидина позволяет осуществить внутримолекулярную циклизацию с образованием производных хинолина [204]:



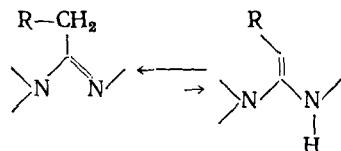
Ряд исследований посвящен синтезу пиридинов на основе реакций амидинов с илиденмалононитрилами [205, 206]:



Реакция подобного типа протекает и между форм- или ацетамидином и димером малононитрила — в этом случае также образуются тетра- или пентазамещенные пиридины [42]:

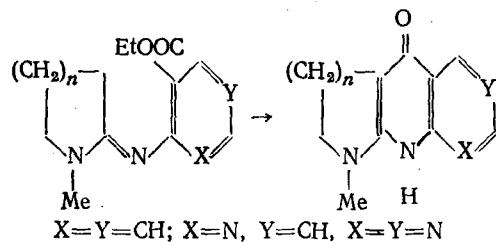


Другой подход к синтезу различного типа пиридинов содержащих гетероциклов основан на упомянутом выше (стр. 686) принципе «потенциальной енаминизации». Смысл этого принципа заключается в том, что протоны $\text{CH}_2(\text{CH}_3)$ -групп, присоединенных к амидиновому мезо-углеродному атому, достаточно подкислены и могут при определенных условиях отщепляться, создавая тем самым основу для электрофильного замещения, например, для дейтерообмена (стр. 686) или внутримолекулярных циклизаций. При этом возможно промежуточное образование енаминов, хотя экспериментально их появление и не зафиксировано⁶.

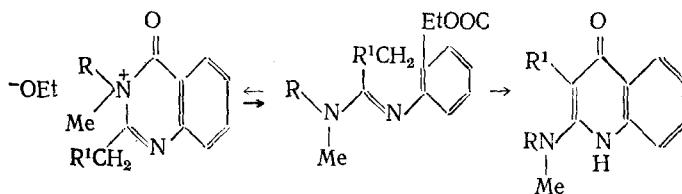


⁶ Совсем недавно при исследовании синтеза пиридинов получены определенные доводы в пользу существования такого амидин-ендиаминного таутомерного равновесия (см. стр. 696).

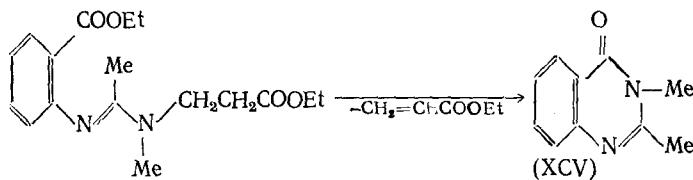
С использованием этого подхода осуществлен ряд синтезов пиридонон-4, хинолонов-4, производных пирроло-, пиридо-, азепинохинолинов, пирроло-, пиридо- и азепинонафтиридинов, пирроло-, пиридо- и азепинопиридо[2,3-d]пиrimидинов [60, 207—212]:



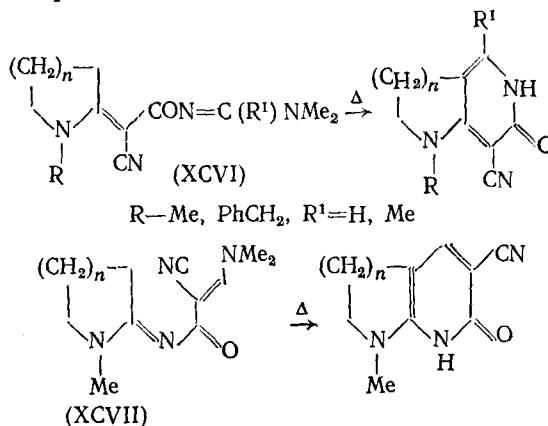
Первоначально, по-видимому, протекает, обратимая циклизация по азоту амидиновой системы и равновесие затем сдвигается вправо, за счет необратимого процесса образования пиридона:



Такое предположение подтверждается обнаруженным в работе [209] фактом, что когда заместитель R может отщепляться в виде стабильной молекулы, в качестве единственного продукта реакции образуется производное хиназолона (XCV) [209]:

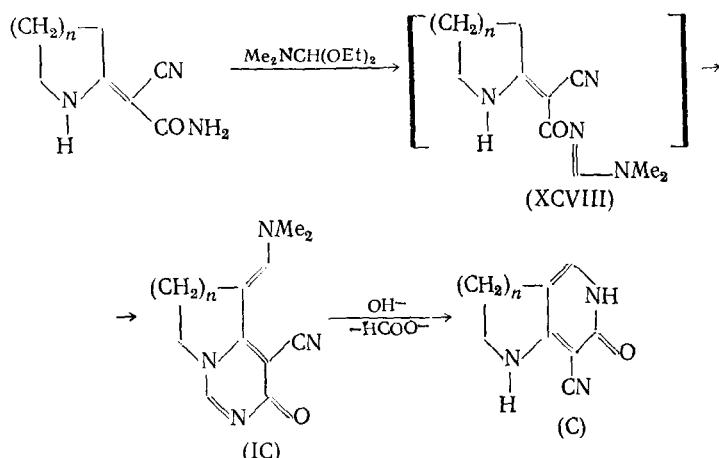


Весьма перспективным классом соединений для синтеза различных конденсированных пиридинов оказались енаминоациламидины (XCVI), (XCVII) [213—218]

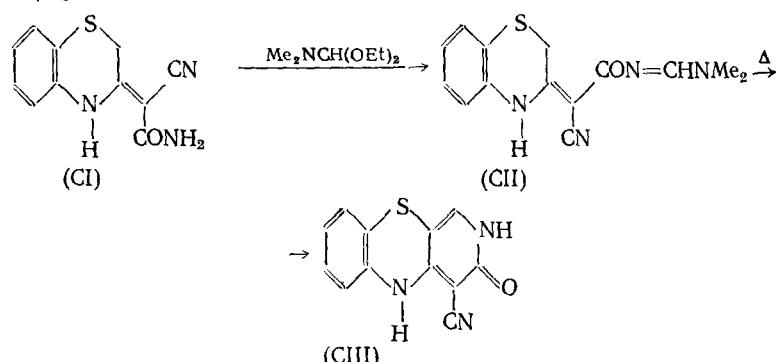


Исследование кинетики обоих типов реакций, показало, что скорость циклизации много выше для (XCVI), чем для (XCVII) [216], что отвечает лучшей делокализации положительного заряда в амидиновой системе по сравнению с енаминовой. Енаминоациламидины (XCVIII) являются промежуточными соединениями и в новом пиридиновом синтезе [215,

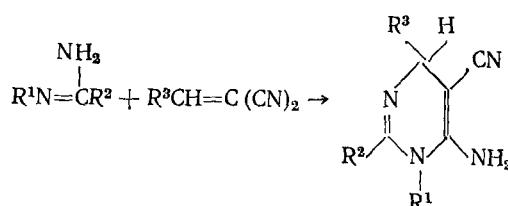
217, 219—223]:



Интересно, что конденсированные пиримидины (IC) ведут себя подобно циклическим амидинам (стр. 681) и легко гидролизуются в щелочной среде с отщеплением муравьиной кислоты [219, 220] и рециклизацией в производные пиридона-2 (C) [217, 219—222]. При использовании в реакции подобного типа енаминоамида (CI), полученного на основе бензтиазиона-2 оказалось, что промежуточный ациламидин (CII) при нагревании циклизуется не в производное пиримидина, а в пиридобензтиазин (CIII) [223]:



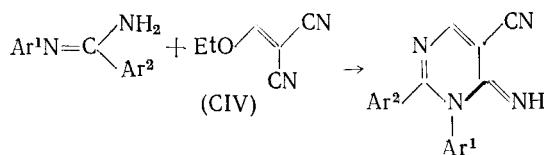
Производные пиримидина гладко образуются при взаимодействии амидинов с различными трехуглеродными компонентами, такими как ди-карбонильные [224], енаминокарбонильные [225, 226] соединения, ацетилендикарбоновый эфир [64]. Замещенные пиримидины образуются также при взаимодействии амидинов с различными производными бензопирона-4 [227—229] или пирилиевыми солями [230]⁷. Реакция амидинов с илиденмалононитрилами приводит к дигидропиримидинам [232, 233]:



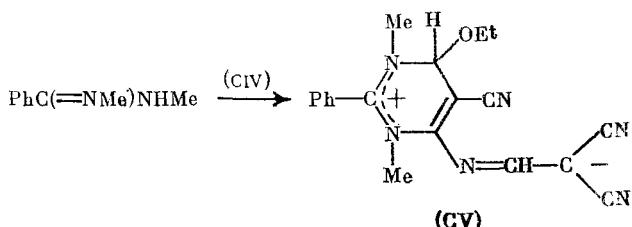
В работе [174] показано, что для амидинов, имеющих первичную аминогруппу, реакция с этоксиметиленмалононитрилом (CIV) протекает

⁷ Обзор по трансформации кислородсодержащих циклов в пиримидины под действием амидинов (и гуанидинов) см. [231].

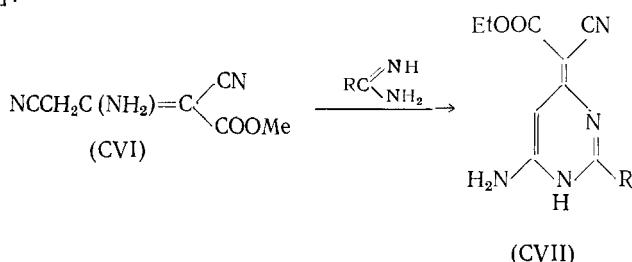
обычным образом с образованием 4-иминопиримидинов:



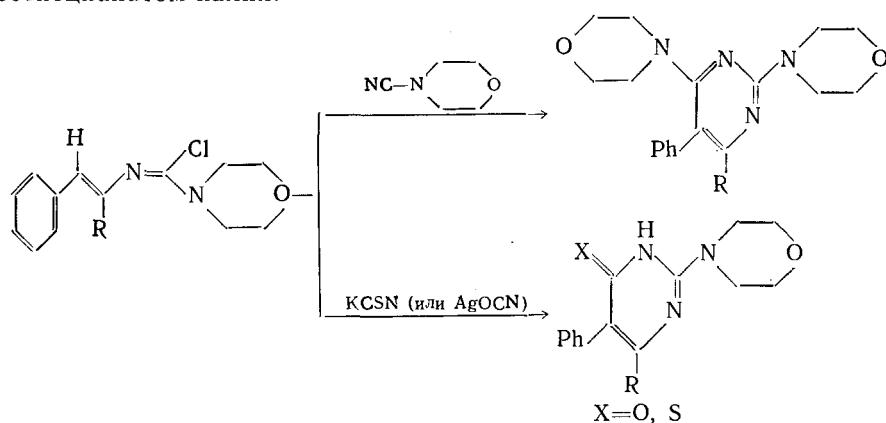
Однако с N,N'-дизамещенными амидинами (CIV) реагирует иначе, и продуктом реакции в этом случае является цвиттер-ионный 1:2-аддукт (CV) [172]:



Взаимодействие содимера малонитрила и циануксусного эфира (CVI) с бенз- и ацетамидинами (но не с формамидином — в этом случае образуются пиридины) приводит к производным 4-метиленпириимида (CVII) [42]:

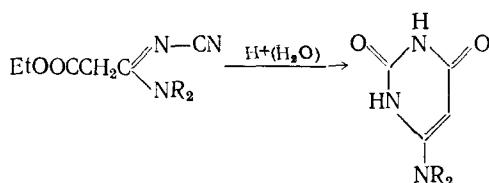


Для синтеза производных пириимида успешно могут быть использованы замещенные хлорформамидины [234], которые для этой цели вводят в реакции с производными цианамида, изоцианатом серебра или изотиоцианатом калия:

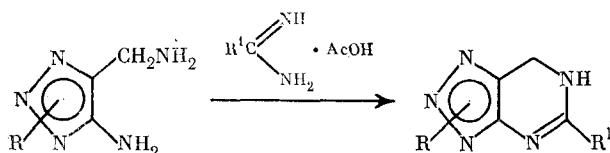


Соли енаминоамидинов также могут быть источником пириимида как непосредственно — путем их реакции с амидинами [6], так и после их перевода в енаминоамидины типа (XCIV) (стр. 690) с последующей обработкой фенилизотиоцианатом [203]. Недавно опубликован [235] новый синтез пириимидинионов-2,4 путем внутримолекулярной циклизации

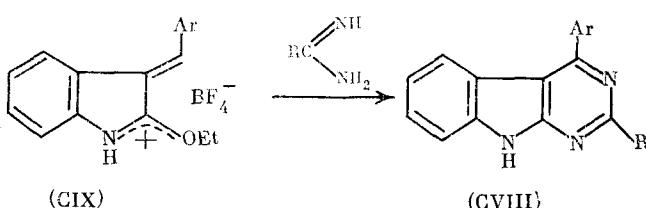
ции N-цианамидинов:



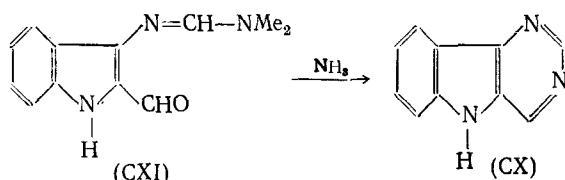
Некоторые амидины использованы недавно [236] в качестве одноуглеродной компоненты в целях получения конденсированных пиридинов:



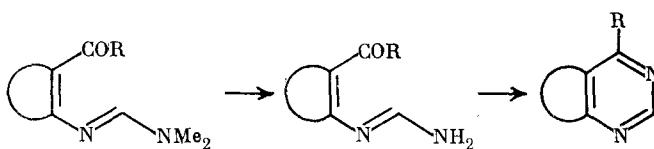
Наличие в соседних положениях амидиновой и карбамидной функций обеспечивает возможность замыкания пиридинового цикла при взаимодействии с формамидом [237]. Пиримидоиндолы (CVIII) успешно синтезированы реакцией амидинов с фторборатными комплексами (CIX) [238, 239]:



Синтез пиримидоинолов другого типа (CX) осуществлен реакцией индольного амидина (CXI) с аммиаком, первичными аминами, гидроксиламином [240], например:

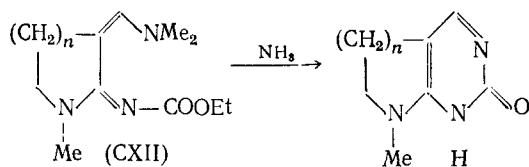


В пиримидиновом синтезе этого типа первой стадией обычно является переаминирование с последующей циклизацией с участием находящейся рядом карбонилсодержащей группы.

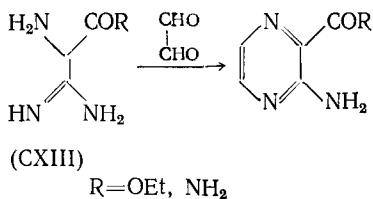


Этим методом получены антрапиридины [151], пиразоло- [152] и пиридопиридины [211]. Новый синтез пиридинов и производных пирроло-, пиридо- и азепино[2,3-d]пиридинов основан на реакции енами-

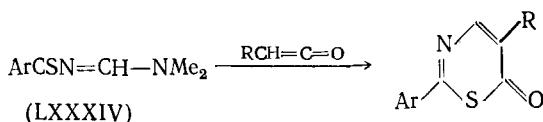
ноамидинов (типа (CXII)) с аммиаком [52]:



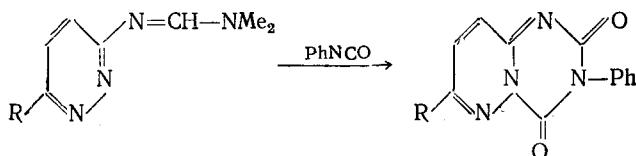
Аминоамидины (CXIII) оказались удобными исходными продуктами для получения 2-амино-3-этоксикарбонилпиразинов — важных промежуточных соединений в синтезе птеридинов [241, 242]:



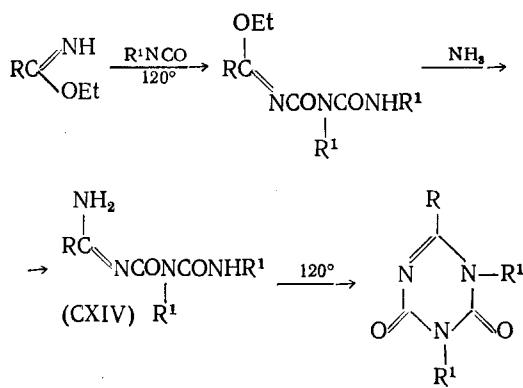
Уже упоминавшиеся N-тиоациламидины (LXXXIV) (стр. 688) были использованы для получения 1,3-тиазинонов-6 [197, 243]:



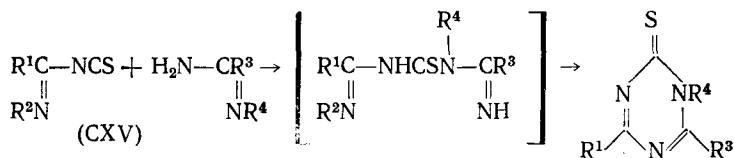
Большое количество исследований посвящено синтезу производных триазина на основе амидинов. Основная часть этих синтезов связана с применением в качестве второй реакционной компоненты различных изоцианатов и изотиоцианатов, например фенилизоцианата [150, 244] — в этих случаях в реакцию вводились N-гетариламидины.



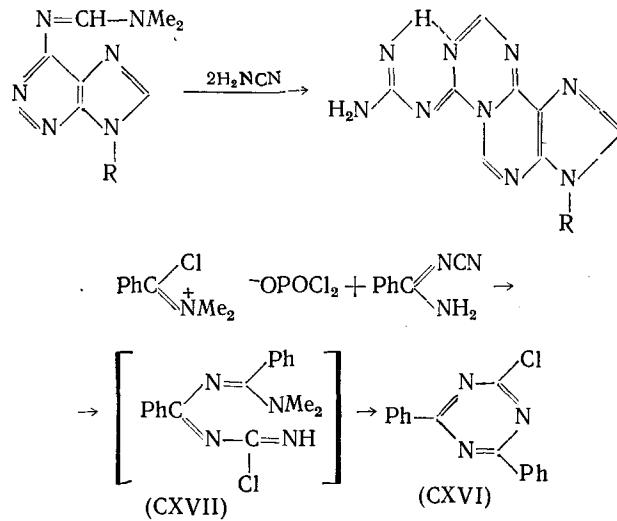
[1,2]-Аддукты (триазиндионы или триазиндитионы) образуются также при взаимодействии амидинов с бензолсульфонилизоцианатом [168] или с метилизоцианатом [168, 169]. Сюда же примыкает исследование касающееся синтеза производных триазина внутримолекулярной циклизацией амидина (CXIV), полученного обработкой соответствующего иминоэфира R¹NCO и затем аммиаком [245]:



симм-Триазинтионы получены также взаимодействием иминоизотиоцианатов (CXV) с амидинами [246, 247]:

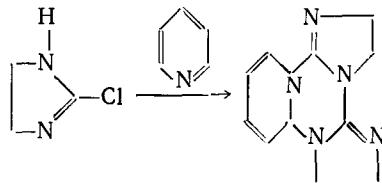


К другим способам получения триазинов относятся реакции амидинов с цианамидом [43] и взаимодействие N-цианамидинов и комплексов амидов с хлорокисью фосфора [248]:

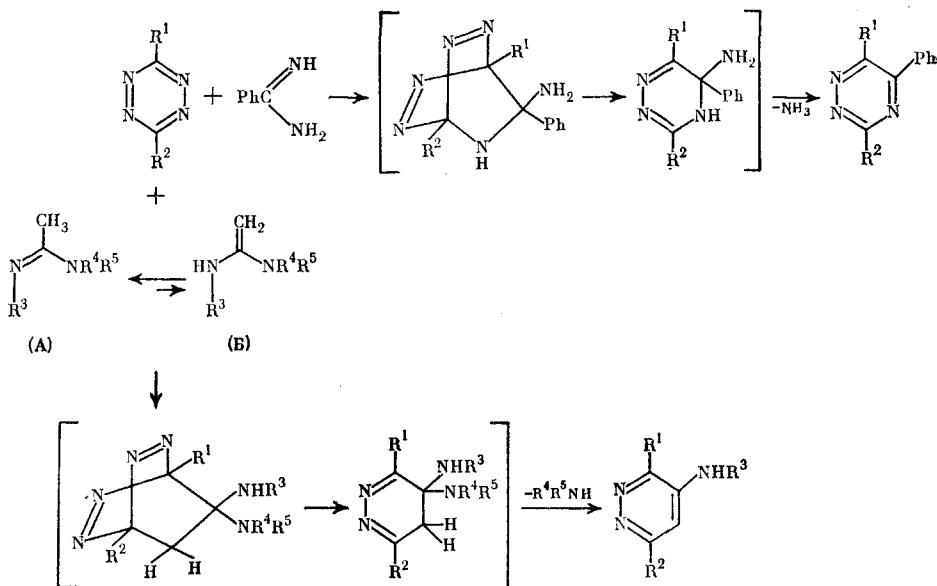


Автор не объясняет почему образуется хлортриазин (CXVI), однако можно предположить, что циклизации подвергается промежуточный имидхлорид (CXVII).

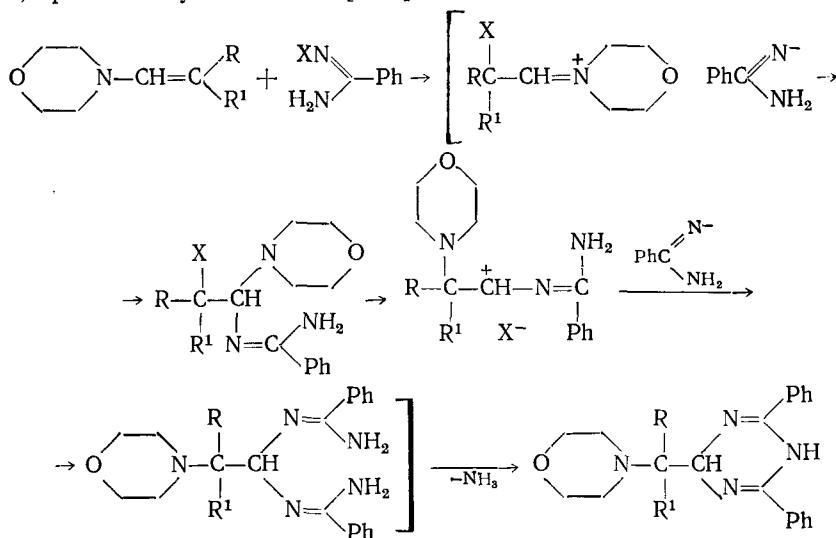
При взаимодействии циклических хлорформамидинов с пиридином или хинолином также замыкается триазиновый цикл [249]:



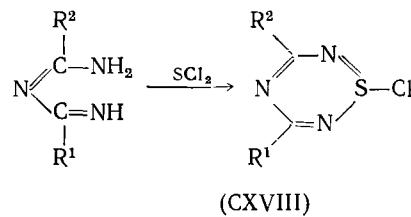
В реакции с тетразинами амидины выступают в качестве диенофила — в результате образуются 1,2,4-триазины [250]. Существенно, что когда в аналогичную реакцию вводят N,N,N'-тризамещенные амидины в качестве продуктов образуются пиридазины [251]. Авторы считают, что такое протекание процесса является следствием наличия амидин — едиаминного равновесия (A \rightleftharpoons B) [215] (см. также стр. 690).



И, наконец, отметим интересную реакцию N-галогенамидинов с енами-нами, протекающую по схеме [252]:



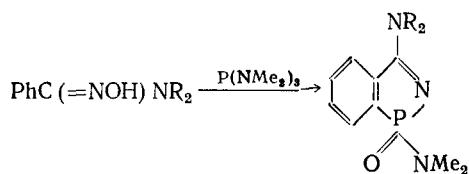
Производное 1,2,4,6-тиатриазина (CXVIII) получено взаимодействием имидоиламидинов с двуххлористой серой [253]:



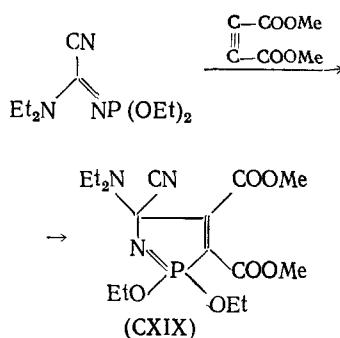
Если в такую реакцию вводят N-ариламидины, то образуются производные 4-хлор-4-тиахиназолинов [254].

И в заключение этого раздела укажем на исследования, посвященные синтезу фосфор- и борсодержащих гетероциклов. Наибольшее число таких работ посвящено фосфатриазинам — их получение осуществлено взаимодействием N-циан- [255] или N-имидоиламидинов [256] с пятихлористым фосфором, трихлорфосфазосоединений с амидинами или

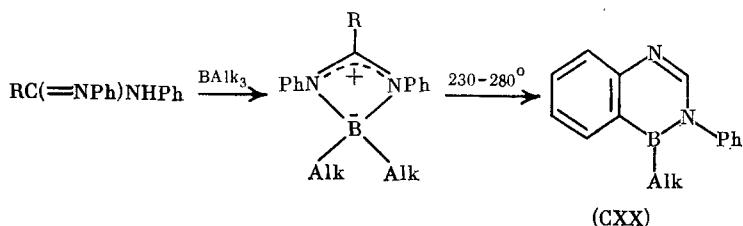
Н-дихлорфосфониламидинами [94], а также реакцией N-оксиамидинов с фосфинами [257]. Последняя реакция относится к N-оксиамидинам, не замещенным по второму азоту. Для N-замещенных соединений реакция протекает по другому и замыкается не шести-, а пятичленный цикл [257]:



Фосфорсодержащие амидины использованы в синтезе производных азофосфолов (CIXIX) [166]:



Поскольку борамидинам посвящен упомянутый уже выше обзор [7] укажем здесь лишь на одну, недавно опубликованную работу по синтезу борхиназолинов (CXX) [258]:



* * *

В настоящем обзоре рассмотрены литературные данные, касающиеся химии амидинов и не затронуты результаты исследования родственных систем, таких как производные гуанидина, O- и S-замещенные мочевины и тиомочевины. Лишь в отдельных случаях обзор касается химии амидиниевых солей, тем более, что их свойствам посвящен ряд недавно опубликованных обзоров [6, 259]. Рассмотрение материала по указанным типам соединений совместно с данными по химии амидинов в рамках одной статьи вряд ли возможно.

Резюмируя литературные данные можно утверждать, что развитие химии амидинов обусловило развитие различных областей органической химии, в первую очередь химии гетероциклов, и оказалось весьма плодотворным в теоретическом и практическом отношениях.

ЛИТЕРАТУРА

1. The Chemistry of amidines and imidates. Ed Patai S. London — New York — Sydney — Toronto: John Wiley and Sons, 1975.
2. Oediger H., Moller F., Eiter K. Synthesis, 1972, p. 591.
3. Wamhoff H., Korte F. Ibid., 1972, p. 151.
4. Miocque M., Fauran C. Ann. Chim. (Paris), 1972, t. 7, p. 89.
5. Asghar S. S. J. Mol. Med., 1977, v. 2, p. 1.
6. Lloyd D., McNab H. In: New Synthetic Methodss. Weinheim — New York: Verlag Chemie, 1979, v. 5, p. 209.
7. Mikhailov B. M. Pure Appl. Chem., 1977, v. 49, p. 749.
8. Wagner G., Wunderlich J. Pharmazie, 1976, B. 31, S. 766.
9. Wagner G., Voight B., Danicke D., Liebermann T. Ibid., 1976, B. 31, S. 528.
10. Tidwell R. R., Fox L. L., Geratz J. D. Biochem. Biophys. Acta, 1976, v. 445, p. 729.
11. Пантелей Т., Георгиева Р. Фармация (София), 1979, т. 29, с. 1.
12. McCarthy J. R. Бельг. пат. 831934 (1976); С. А., 1976, v. 85, 116817.
13. McCarthy J. R. Пат. Великобритании 1466047 (1977); С. А., 1977, v. 87, 117663.
14. Strebelle M., Fuks R. Bull. Soc. Chim. Belg., 1978, v. 87, p. 717.
15. Fuks R. Tetrahedron, 1973, v. 29, p. 2147.
16. Hoch H., Schewermann H. Пат. ФРГ 2604196 (1977); С. А., 1978, 88, 22333.
17. Fuks R. Bull. Soc. Chim. Belg., 1973, v. 82, p. 571.
18. Fuks R. Europ. Polym. Sci., 1973, v. 9, p. 835.
19. Ogonor J. I. Tetrahedron, 1981, v. 37, p. 2909.
20. Yasumoto M., Yanagiya K., Kurabayashi M. Яп. пат. 7392301 (1973); С. А., 1974, v. 80, 145849.
21. Пассет Б. В., Кульбацик Г. Н., Калашникова Н. А., Воропаева Т. И. Ж. орг. химии, 1972, т. 8, с. 1246.
22. Глушков Р. Г., Граник В. Г. Успехи химии, 1969, т. 38, с. 1969.
23. Glode G., Haase L., Gross H. Z. Chem., 1969, B. 9, S. 201.
24. Граник В. Г., Пятин Б. М., Глушков Р. Г. Успехи химии, 1971, т. 40, с. 1593.
25. Граник В. Г., Жидкова А. М., Глушков Р. Г. Там же, 1977, т. 46, с. 685.
26. Abdulla R. F., Brinkmeyer R. S. Tetrahedron, 1979, v. 35, p. 1675.
27. Simchen G. In: Iminium Salts in Organic Chemistry, part 2. Ed. Böhme H., Viehe H. G. New York: Wiley, 1979, p. 393.
28. Kato T., Takada A., Ueda T. Chem. Pharm. Bull. 1972, v. 20, p. 901.
29. Nii Y., Okano K., Kobayashi S., Ohto M. Tetrahedron Letters, 1979, p. 2517.
30. Князева В. Ф., Граник В. Г., Глушков Р. Г., Арутюнян Г. С. Хим. фарм. ж., 1981, № 5, с. 44.
31. Pedersen E. B., Lawesson S. O. Tetrahedron, 1973, v. 29, p. 4205.
32. Pedersen E. B. Acta Chem. Scand., B., 1977, v. 31, p. 261.
33. Глушков Р. Г. Автореферат дисс. на соискание уч. ст. докт. хим. наук. М.: МХТИ им. Менделеева, 1971.
34. Besan J., Kulcsar L., Kovacs M. Synthesis, 1980, p. 883.
35. Глушков Р. Г., Засосова И. М., Овчарова И. М. Хим. гетероцикл. соед., 1977, с. 1398.
36. Pedersen E. B. Synthesis, 1979, p. 546.
37. Ogata M., Matsumoto H. Heterocycles, 1978, v. 11, p. 139.
38. Schnur R. C. J. Org. Chem., 1979, v. 44, p. 3726.
39. Janousek Z., Viehe H. G. In: Iminium Salts in Organic Chemistry, part 1. Ed. Böhme H., Viehe H. G. New York: Wiley, 1976, p. 343.
40. Viehe H. G., Janousek Z. Angew. Chem., 1973, B. 85, S. 837.
41. Taylor E. C., Dumas D. J. J. Org. Chem., 1980, v. 45, p. 2485.
42. Junek H., Mittelbach M., Thierricher B. Monatsch. Chem., 1979, v. 110, p. 1279.
43. Kosmane R. S., Leonard N. J. J. Org. Chem., 1981, v. 46, p. 1457.
44. Граник В. Г., Сочнева Е. О., Персианова И. В. Хим. гетероцикл. соед., 1978, с. 379.
45. Fitt J. J., Gschwend H. W. J. Org. Chem., 1977, v. 42, p. 2639.
46. Kanthlechner W., Wagner F., Bredereck H. Ann., 1980, S. 344.
47. Lin Y-i, Lang S. A., Lovell M. F., Perkinson N. A. J. Org. Chem., 1979, v. 44, p. 4160.
48. Lin Y-i, Lang S. A., Petty S. P. Ibid., 1980, v. 45, p. 3750.
49. Lin Y-i, Lang S. A. Synthesis, 1980, p. 119.
50. Gupton J. T., Colon C., Harrison C. R., Lizzi M. J., Polk D. E. J. Org. Chem., 1980, v. 45, p. 4522.
51. Gold H. Angew. Chem., 1960, v. 72, p. 956.
52. Кайманакова С. И., Кулешова Е. Ф., Соловьева Н. П., Граник В. Г. Хим. гетероцикл. соед., 1982, с. 1553.
53. Ellgehausen D. Chimia, 1976, B. 30, S. 387.
54. Глушков Р. Г., Дронова Л. И., Николаева Л. А., Костикова Ю. И. Хим. фарм. ж., 1978, № 1, с. 93.
55. Глушков Р. Г., Дронова Л. И., Николаева Л. А., Медведев Б. А., Машковский М. Д., Соловьева Н. П., Турин К. Ф., Персианова И. В. Там же, 1978, № 6, с. 59.
56. Глушков Р. Г., Дронова Л. И., Николаева Л. А., Медведев Б. А., Машковский М. Д. Там же, 1981, № 6, с. 39.
57. Tritschler W., Kausz S. Synthesis, 1972, p. 32.
58. Tritschler W., Kausz S. Ibid., 1973, p. 423.

59. Bitter J., Karpati A., Toke L. *Acta Chim. Acad. Sci. Hung.*, Tomus, 1979, v. 102, p. 235.
60. Граник В. Г., Марченко Н. Б., Соинева Е. О., Глушков Р. Г., Власова Т. Ф., Шейнкер Ю. Н. Хим. гетероцикл. соед., 1976, с. 805.
61. Граник В. Г., Марченко Н. Б., Соинева Е. О., Власова Т. Ф., Григорьев А. Б., Поплавков М. К., Глушков Р. Г. Там же, 1976, с. 1505.
62. Cook L. S., Wakefield B. J. *Tetrahedron Letters*, 1976, p. 147.
63. Cook L. S., Wakefield B. J. J., *Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 1980, p. 2392.
64. Приказчикова Л. П., Рыбченко Л. И., Черкасов В. М. Хим. гетероцикл. соед., 1977, с. 831.
65. Rocar D., Trimarco P. *J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 1976, p. 622.
66. Rajappa S., Sreenivasan R. *Ind. J. Chem.*, 1979, v. 178, p. 339.
67. Kaji K., Matsubara H., Nagashima H., Kikugawa Y., Yamada S. *Chem. Pharm. Bull. Japan*, 1978, v. 26, p. 2246.
68. Lettiere G., Larizza A., Brancaccio G., Monforte P. *Atti. Soc. Peloritana Sci. Fis., Mat., Nat.*, 1978, v. 24, № 1, p. 77; *C. A.* 1980, v. 92, 94028.
69. Ried W., Christ R. *Ann.*, 1980, S. 693.
70. Абражанова Е. А., Севастьянов В. Н., Пронский А. Ф. *Ж. орг. химии*, 1975, т. 11 с. 2243.
71. Ried W., Dietzschmann H. *Ann.*, 1981, S. 1009.
72. Kharsan R. S., Mishra R. K. *Ind. J. Chem.*, 1975, v. 13, p. 295.
73. Satyanarayana K., Mishra R. K. *Anal. Chem.*, 1974, v. 46, p. 1609.
74. Халилова С. Ф., Поплавская Н. А. *Изв. АН КазССР. сер. хим.* 1977, т. 27, № 1, с. 61.
75. Jakobsen P., Treppendahl S. *Tetrahedron*, 1977, v. 33, p. 3137.
76. Hegarty A. F., Chandler A. *Chem. Commun.*, 1980, p. 130.
77. Hegarty A. F., Chander A. *Tetrahedron Letters*, 1980, p. 885.
78. Marmet D., Boullanger P., Descotes G. *Ibid.*, 1980, p. 1459.
79. Magosch K. H. *Synthesis*, 1972, p. 37.
80. Henklein P., Westphal G. Z. *Chem.* 1973, B. 13, S. 429.
81. Fuks R., Strelle M., Wenders A. *Synthesis*, 1977, p. 788.
82. Möhrle H., Scharf U. *Arch. Pharm.*, 1974, B. 307, S. 51.
83. Morimura S. *Heterocycles*, 1980, v. 14, p. 1449.
84. DenBril M. V., Fuks R. *Synthesis*, 1980, p. 893.
85. Fuks R., Den Bril M. V. *Tetrahedron*, 1981, v. 37, p. 2895.
86. Den Bril M. V., Fuks R. *Ibid.*, 1981, v. 37, p. 2905.
87. Fuks R., Den Bril M. V. *Synthesis*, 1980, p. 121.
88. Ohmori M., Miyazaki Y., Hasegawa K., Watanabe Y., Utsuki Y. Яп. пат. 7512408 (1975); *C. A.* 1975, v. 83, 178370.
89. Halliday J. D., Symons E. A., Bennett J. D. *Canad. J. Chem.*, 1978, v. 56, p. 1455.
90. Дубина В. Л., Педан В. П., Дембинский И. К. *Ж. орг. химии*, 1976, т. 12, с. 64.
91. Minami T., Takimoto F., Agawa T. *Bull. Chem. Soc. Jap.*, 1975, v. 48, p. 3259.
92. Hocker J., Merten R. *Ann.*, 1978, S. 16.
93. Мартынов А. В., Мирскова А. П., Калихман И. Д., Макеров П. В., Воронков М. Н. *Ж. орг. химии*, 1979, т. 15, с. 427.
94. Кухарь В. П., Кащева Т. Н. *Ж. общей химии*, 1976, т. 46, с. 1462.
95. Мироновская Н. М., Дымова С. Ф., Владимирова И. Л., Мельников Н. Н. Там же, 1978, т. 48, с. 2465.
96. Синица А. Д., Кальченко В. И. *Докл. АН СССР, сер. Б.*, 1977, с. 1008.
97. Maringele W., Meller A. Z. *Anorg. allg. Chem.*, 1978, B. 445, S. 107.
98. Kovalev I. B., Borodavko N. D. *Ж. орг. химии*, 1981, т. 17, с. 2022.
99. Харченко А. В., Кремлев М. М., Коваль И. В. Там же, 1977, т. 13, с. 459.
100. Харченко А. В., Коваль И. В., Кремлев М. М. Там же, 1979, т. 15, с. 443.
101. Reynaud P., Brion J. D., Menard G. *Bull. Soc. chim. France*, 1976, № 1—2, Part 2, p. 301.
102. Wicherink S. C., Scheerend J. W., Nivard R. J. F. *Synthesis*, 1976, p. 273.
103. Sieveking H. U., Luttkie W. *Ann.*, 1977, S. 189.
104. Kolb R., Schwenker G. *Chem. Ber.*, 1973, B. 106, S. 105.
105. Pandeya S. N., Pam P. *Current. Sci. (India)*, 1980, 302.
106. Дорохов В. А., Бочкирева М. Н., Болдырева А. Г., Рассадин Б. В., Михайлов Б. М. *Изв. АН СССР, сер. хим.*, 1979, с. 411.
107. Енгоян А. П., Шейнкер Ю. Н., Власова Т. Ф., Курило Г. Н., Гринев А. Н. Хим. гетероцикл. соед., 1972, с. 225.
108. Соловьева И. П., Переслени Е. М., Немерюк М. П., Травень Н. И., Сафонова Т. С., Шейнкер Ю. Н. Там же, 1975, с. 1128.
109. Naulet N., Filleux M. L., Martin C. J., Pernet J. *Org. Magn. Res.* 1975, v. 7, p. 326.
110. Jakobsen P., Treppendahl S. *Tetrahedron*, 1981, v. 37, p. 829.
111. Кухарь В. П., Шевченко М. В., Кирсанова Н. А. *Ж. орг. химии*, 1973, т. 9, с. 1815.
112. Halliday J. D., Symons E. A., Binder P. D. *Canad. J. Chem.*, 1978, v. 56, p. 1470.
113. Filleux M. L., Naulet N., Dirie J. P., Martin C. J., Pernet J., Miginic L. *Tetrahedron Letters*, 1974, p. 1435.
114. Негребецкий В. В., Бегельфер Л. Я., Кальченко В. И., Синица А. Д., Калинин В. Н. *Докл. АН УССР, сер. Б*, 1980, с. 52.
115. McKennis J. S., Smith P. A. S. *J. Org. Chem.*, 1972, v. 37, p. 4173.
116. Rappoport Z., Ta-Shma R. *Tetrahedron Letters*, 1972, p. 5281.

117. Граник В. Г., Власова Т. Ф., Беляева О. Я., Шейнкер Ю. Н. Ж. орган. химии, 1979, т. 15, с. 272.
118. Ches S. O., Cook M. J., Katritzky A. R. J. Chem. Soc., Perkin Trans. II, 1974, p. 546.
119. Cook M. J., Katritzky A. R., Nadjis S. Ibid., 1976, p. 211.
120. Fernandez B., Perillo I., Lamdan S. Ibid., 1973, p. 1371.
121. Fernandez B., Perillo I., Lamdan S. Ibid., 1973, p. 1416.
122. Perillo I., Fernandez B., Lamdan S. Ibid., 1977, p. 2068.
123. Граник В. Г. Успехи химии, 1982, т. 51, с. 207.
124. Fišnerova L., Crimova J., Němcéek O. Cs. Farm. 1980, v. 29, p. 142.
125. Shridhar D. R., Sastry C. V. R. Ind. J. Chem. 1979, v. 18B, p. 254.
126. Граник В. Г., Жёлкова А. М., Глушков Р. Г., Персианова И. В., Переслени Е. М., Енгоян А. П., Шейнкер Ю. Н. Хим. гетероцикл. соед., 1974, с. 1220.
127. Граник Е. М., Гойзман М. С., Шаназаров К. С. Хим. фарм. ж., 1981, № 9, с. 116.
128. Enders E., Stendel W., Wollweber H. Pestic. Sci., 1973, v. 4, p. 823.
129. Джаров, Д., Крушков Илья. Фармация (София), 1979, т. 29, № 6, с. 14.
130. Satyanarayana K., Mishra R. K. Ind. J. Chem., 1975, v. 13, p. 295.
131. Deb K. K., Mishra R. K. Curr. Sci., 1976, v. 45, p. 134.
132. Cameron N. D., Kilner M. Chem. Commun., 1975, p. 687.
133. Brunner H., Wachter J. J. Chem. Res., S, 1978, p. 136.
134. Минкин В. И., Олехнович Л. П., Жданов Ю. А., Михайлов И. Е., Метлуженко В. П., Иванченко Н. М., Борисенко Н. И. Ж. орг. химии, 1976, т. 12, с. 1260.
135. Минкин В. И., Олехнович О. П., Жданов Ю. А., Михайлов И. Е., Метлуженко В. П., Иванченко Н. М. Там же, 1976, т. 12, с. 1271.
136. Олехнович Л. П., Михайлов И. Е., Иванченко Н. М., Жданов Ю. А., Минкин В. И. Там же, 1979, т. 15, с. 1355.
137. Олехнович Л. П., Минкин В. И., Михайлов И. Е., Иванченко Н. М., Жданов Ю. А. Докл. АН СССР, 1977, т. 233, с. 874.
138. Олехнович Л. П., Михайлов И. Е., Иванченко Н. М., Метлуженко В. П., Жданов Ю. А., Минкин В. И. Ж. орг. химии, 1973, т. 14, с. 340.
139. Клецкий М. Е., Миняев Р. М., Минкин В. И. Там же, 1980, т. 16, с. 686.
140. Halliday J. D., Symons A. Canad. J. Chem. 1978, v. 56, с. 1463.
141. Шапкин В. Л., Попов С. И. Ж. орг. химии, 1980, т. 16, с. 1056.
142. Шапкин В. П., Попов С. И. Там же, 1980, т. 16, с. 160.
143. Шапкин В. П., Попов С. И. Там же, 1980, т. 16, с. 230.
144. Chandler A., Hegarty A. F., McCormick M. T. J. Chem. Soc., Perkin Trans., II, 1980, p. 1318.
145. Burdick B. A., Benkovic P. A., Benkovic S. J. J. Am. Chem. Soc., 1977, v. 99, p. 5716.
146. Benkovic S. J. Acc. Chem. Res., 1978, v. 11, p. 314.
147. Reynaud P., Brion J.-D., Menard G. Bull. Soc. chim. Fr., 1978, № 9—10, Part 2, p. 449.
148. Kreutzberger A., Uzbek M. U. Arch. Pharm., 1972, B. 305, S. 502.
149. Ahlberg P., Ek M. Chimica Scripta, 1976, v. 10, № 1, p. 47.
150. Zupan M., Stanovnik B., Tisler N. J. Org. Chem., 1972, v. 37, p. 2960.
151. Краснова Л. Б., Попов С. И., Докунихин Н. С. Ж. орг. химии, 1973, т. 9, с. 1494.
152. Граник В. Г., Сочнева Е. О., Соловьева И. П., Шварц Г. Я., Сюбаев Р. Д., Машковский М. Д. Хим. фарм. ж., 1980, № 6, с. 36.
153. Севастьянов В. Н., Абражанова Е. А. Ж. орг. химии, 1981, т. 17, с. 91.
154. Абражанова Е. А., Севастьянов В. Н. Там же, 1976, т. 12, с. 780.
155. Ried W., Weidemann P. Chem. Ber., 1971, B. 104, S. 3329.
156. Фокин А. В., Столяров В. П., Гуков А. М., Узун А. Т., Комаров В. А. Изв. АН СССР, сер. хим., 1978, с. 2802.
157. Rogne O. Chem. Commun., 1977, p. 695.
158. Давтян М. М., Круковский С. П., Игнатенко А. В., Пономаренко В. А. Изв. АН СССР, сер. хим., 1977, с. 2775, 2784.
159. Давтян М. М., Круковский С. П., Игнатенко А. В., Пономаренко В. А. Там же, 1980, с. 1414.
160. Фокин А. В., Столяров В. П., Комаров В. А., Узун А. Т. Там же, 1977, с. 2139.
161. Gautier J. A., Miocene M., Le Cloarec A. Y., Furan C., Raynand G., Pourrias B. Франц. пат. 2081556 (1972); С. А. 1972, v. 77, р. 61615.
162. Meth-Cohn O., Narine B. Synthesis, 1980, p. 133.
163. Barker P. L., Gendler P. L., Rapoport H. J. Org. Chem., 1981, v. 46, p. 2455.
164. Шевченко В. И., Кальченко В. И., Синица А. Д. Ж. общей химии, 1977, т. 47, с. 2157.
165. Маковецкий М. С., Рудавский В. П., Рогозянский А. В., Шатурский Я. П., Наукові Праці Уста, 1973, т. 62, с. 156.
166. Шевченко В. П., Синица А. Д., Кальченко В. И. Ж. общей химии, 1976, т. 46, с. 541.
167. Shioiri T., Kawai N., Ban M. Яп. пат. 7959238 (1979); С. А. 1979, v. 91, 156827.
168. Veronese A. C., Di Bello C., Filiza F., D'Angel F. Gazz. Chim. Ital., 1971, v. 101, p. 569.
169. Schwenker G., Kolb B. Chem. Ber., 1975, B, 108, S. 1142.
170. Kolb R., Schwenker G. Tetrahedron Letters, 1972, p. 4699.
171. Толмачева Г. М., Круковский С. П., Берман Е. П., Пономаренко В. А. Изв. АН СССР, сер. хим., 1976, с. 1963.
172. Hartke K., Wolf H. M. Arch. Pharm., 1980, B. 313, S. 208.
173. Wolf H. M., Hartke K. Ibid., 1980, B. 313, S. 215.

174. Робев Ст. Доклады Болг. АН, 1980, т. 33, с. 635.
175. Graefe J. Z. Chem. 1975, B, 15, S. 301.
176. Meyers A. I., Hoeve W. T. J. Am. Chem. Soc., 1980, v. 102, p. 7125.
177. Граник В. Г., Жидкова А. М., Власова Т. Ф., Глушков Р. Г., Шейнкер Ю. Н. Хим. гетероцикл. соед., 1974, с. 533.
178. Граник В. Г., Жидкова А. М., Анисимова О. С., Глушков Р. Г. Там же, 1975, с. 710.
179. Граник В. Г., Марченко Н. Б., Буданова Н. Б., Кузовкин В. А., Власова Т. В., Анисимова О. С., Глушков Р. Г. Ж. орг. химии, 1975, т. 11, с. 1829.
180. Граник В. Г., Беляева О. Я., Глушков Р. Г., Власова Т. Ф., Григорьев А. Б., Полиевктов М. К. Хим. гетероцикл. соед., 1977, с. 1518.
181. Граник В. Г., Жидкова А. М., Глушков Р. Г., Григорьев А. Б., Полиевктов М. К., Власова Т. Р., Анисимова О. С. Там же, 1977, с. 1348.
182. Su G. C. C., Zabic M. J. J. Agricul. Food Chem., 1972, v. 20, № 2, p. 320.
183. Swanson B. J., Crockett G. C., Koch T. H. J. Org. Chem., 1981, v. 46, p. 1082.
184. L'Abbe G., Asch A. V., Dekerk J. P. Tetrahedron Letters, 1981, p. 583.
185. Eicher T., Abdesaken F., Franke G., Weber J. L. Ibid., 1975, p. 3915.
186. Potts K. T. Chem. S. J. J. Org. Chem., 1977, v. 42, p. 1639.
187. Potts K. T. Husain S. Ibid., 1971, v. 36, p. 3368.
188. Hamaguchi M., Ubata T. Chem. Letters, 1975, p. 169.
189. Citerio L., Pocar D., Stradi R. J. Chem. Soc., Perkin Trans. I, 1978, p. 309.
190. Pocar D., Stradi R. Tetrahedron Letters, 1976, p. 1839.
191. Citerio L., Pocar D., Saccarello M. L., Stradi R. Tetrahedron, 1979, v. 35, p. 2453.
192. Виноградова Т. К., Миськевич Г. И., Драч В. С. Ж. орг. химии, 1980, т. 16, с. 1869.
193. Еремеев А. В., Элькинсон Р. С., Лиепиньш Э., Имулс В. А. Хим. гетероцикл. соед., 1980, с. 1624.
194. Schaumann E., Grabley S. Chem. Ber. 1980, B, 113, S. 934.
195. Еришова И. И., Гевазо Ю. И., Станинец В. И. Укр. хим. ж., 1977, т. 43, с. 884.
196. Lin Y-i, Seifert C. M., Kang S. M., Dusza J. P., Lang S. A. J. Heterocycl. Chem., 1979, v. 16, p. 1377.
197. Meslin J. C., Quinon H. Tetrahedron, 1975, v. 31, p. 3055.
198. Decroix B., Pastour P. J. Chem. Res. S, 1978, № 4, p. 132.
199. Lin Y-i, Lang S. A. J. Org. Chem., 1981, v. 46, p. 3123.
200. Dimsdale M. J. J. Heterocycl. Chem., 1981, v. 18, p. 37.
201. Seale P. W., Warburton W. K. J. Chem. Soc., Perkin Trans. I, 1974, p. 85.
202. L'Abbe, Verbruggen A. Tetrahedron Letters, 1979, p. 49.
203. Gompper R., Heinemann U. Angew. Chem., 1980, B, 92, S. 208.
204. Viehe H. G., Voghel G. J., Smets F. Chimia, 1976, B, 30, S. 189.
205. Robev S. K. Heterocycles, 1980, v. 14, p. 461.
206. Robev S. K. Tetrahedron Letters, 1980, v. 21, p. 2097.
207. Жидкова А. М., Граник В. Г., Глушков Р. Г., Власова Т. Ф., Анисимова О. С., Гуськова Т. А., Першин Г. Н., Хим. гетероцикл. соед., 1974, с. 670.
208. Граник В. Г., Жидкова А. М., Киселев С. С., Глушков Р. Г., Полежаева А. И., Машковский М. Д. Хим. фарм. ж., 1978, № 7, с. 66.
209. Марченко Н. Б., Граник В. Г., Власова Т. Ф., Анисимова О. С., Глушков Р. Г. Хим. гетероцикл. соед., 1976, с. 665.
210. Pedersen E. B., Lawesson S. O. Acta Chim. Scand., B, 1974, v. 28, p. 1045.
211. Сочнева Е. О., Соловьева Н. П., Граник В. Г. Хим. гетероцикл. соед., 1978, с. 1671.
212. Граник В. Г., Марченко Н. Б., Глушков Р. Г. Там же, 1978, с. 1549.
213. Граник В. Г., Марченко Н. Б., Власова Т. Ф., Глушков Р. Г. Там же, 1976, с. 1509.
214. Граник В. Г., Беляева О. Я., Глушков Р. Г. Власова Т. Ф., Анисимова О. С. Там же, 1977, с. 1106.
215. Азимов В. А., Граник В. Г., Глушков Р. Г., Яхонтов Л. Н. Там же, 1978, с. 355.
216. Граник В. Г., Григорьев А. Б., Полиевктов М. К. Там же, 1977, с. 1523.
217. Граник В. Г., Сочнева Е. О., Соловьева Н. П. Там же, 1980, с. 1120.
218. Азимов В. А., Бычихина Н. Н., Яхонтов Л. Н. Там же, 1981, с. 1283.
219. Граник В. Г., Сочнева Е. О., Соловьева Н. П. Там же, 1980, с. 416.
220. Граник В. Г., Жидкова А. М., Дубинский Р. А. Там же, 1981, с. 289.
221. Граник В. Г., Жидкова А. М., Дубинский Р. А. Там же, 1982, с. 518.
222. Граник В. Г., Жидкова А. М. Тез. докл. V Всесоюз. коллоквиума. Химия, биохимия, и фармакология производных индола. Тбилиси, 1981, с. 21.
223. Chorvat R. J., Radak S. E., Searle G. D. Tetrahedron Letters, 1980, p. 421.
224. Ароян А. Л., Крамер М. С., Саакян А. Г. Арм. хим. ж., 1975, т. 28, с. 150.
225. Warmhoff H., Materne C. Ann., 1971, B, 754, S. 113.
226. Глушков Р. Г., Беляева О. Я., Граник В. Г., Полиевктов М. К., Григорьев А. Б., Серохвостова В. Е., Власова Т. Ф. Хим. гетероцикл. соед., 1976, с. 1640.
227. Хия В. П., Голубушина Г. М., Мейта Е. Н., Корнилов М. Ю. Докл. АН УССР, 1980, сер. Б, с. 57.
228. Lowe W. Ann., 1977, S. 1050.
229. Peterson U., Heitzer H. Ibid., 1976, S. 1663.
230. Жданова М. П., Звездина Э. А., Дорофеенко Г. Н. Хим. гетероцикл. соед., 1978, с. 456.
231. Takagi K., Hubert-Hebart M. Bull. Soc. chim. France, 1977, № 3—4, p. 369.
232. Робев Ст. Докл. Болг. АН, 1971, т. 30, с. 719.
233. Robev S. Tetrahedron Letters, 1978, p. 1163.
234. Ried W., Erle H. E. Chem. Ber., 1979, B, 112, S. 640.

235. *McCall J. M., Kamdar B. V., Kloosterman D.* *Synthesis*, 1980, p. 123.
236. *Albert A. J. Chem. Soc., Perkin Trans. II*, 1976, p. 291.
237. *Kair W. E., Wood H. C. S. J. Chem. Soc.*, 1976, p. 1847.
238. *Боровик В. П., Ивановская Л. Ю., Мамаев В. П.* Изв. Сиб. отд. АН СССР, 1977, № 14, вып. 6, с. 110.
239. *Боровик В. П., Филатова Л. С., Мамаев В. П.* Там же, 1975, № 7, вып. 3, с. 137.
240. *Суворов Н. Н., Черков В. А., Вележева В. С., Ершова Ю. А., Симаков С. В., Севодин В. П.* Хим. фарм. ж., 1981, № 9, с. 27.
241. *Keir W. F., McLennan A. H., Wood H. C. S. J. Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 1978, p. 1002.
242. *Keir W. F., McLennan A. H., Wood H. C. S. Ibid.*, 1977, p. 1321.
243. *Meslin J. C., Quiniou H.* *Synthesis*, 1974, p. 298.
244. *Tisler M., Stanovnik B.* *Chem. Commun.*, 1980, p. 313.
245. *Etienne A., Lonchambon G., Roques J., Lemmens B., Pintard F.* *Compt. rend. C*, 1978, t. 287, p. 285.
246. *Neuffer J., Goerdeler J.* *Chem. Ber.* 1971, B. 104, S. 3498.
247. *Barnikow G., Ebeling H.* *Z. Chem.*, 1973, B. 13, S. 424.
248. *Harris R. L. N.* *Synthesis*, 1980, p. 841.
249. *Saczewski F., Foks H.* *Ibid.*, 1981, p. 154.
250. *Figeys H. P., Mathy A.* *Tetrahedron Letters*, 1981, p. 1393.
251. *Figeys H. P., Mathy A., Dralants A.* *Synth. Commun.*, 1981, p. 655.
252. *Citerio L., Pocar D., Stradi R., Giola B.* *Tetrahedron*, 1979, v. 35, p. 69.
253. *Корнуга П. П., Дерий Л. П., Марковский Л. Н.* Ж. орг. химии, 1980, т. 16, с. 1308.
254. *Марковский Л. Н., Дармохвал Э. А., Левченко Е. С.* Там же, 1973, т. 9, с. 2038.
255. *Корнуга П. П., Колотило Н. В., Марковский Л. Н.* Ж. общей химии, 1977, т. 47, с. 342.
256. *Корнуга П. П., Колотило Н. В.* Там же, 1978, т. 48, с. 1181.
257. *Lopez L., Barrans J. J.* *Chem. Soc., Perkin Trans. I*, 1977, p. 1806.
258. *Дорохов А. В., Болдырева О. Г., Бочкарёва М. Н., Михайлов Б. М.* Изв. АН СССР, сер. хим., 1979, с. 174.
259. *Kantlehner W.* In: *Iminium Salt in Organic Chemistry, part 2*. Ed. Bohme H., Viehe H. G., New York: Wiley, 1979, p. 321.

Всесоюзный научно-исследовательский
Химико-фармацевтический институт
им. С. Орджоникидзе, Москва