

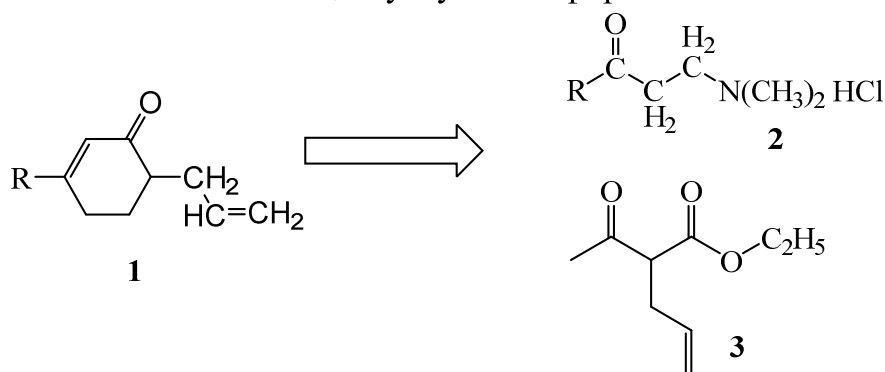
УДК 547.728

Магистрант А.С. Орёл
 Науч. рук.: зав. кафедрой, доц. С.Г. Михалёнок;
 проф. В. С. Безбородов
 (кафедра органической химии, БГТУ)

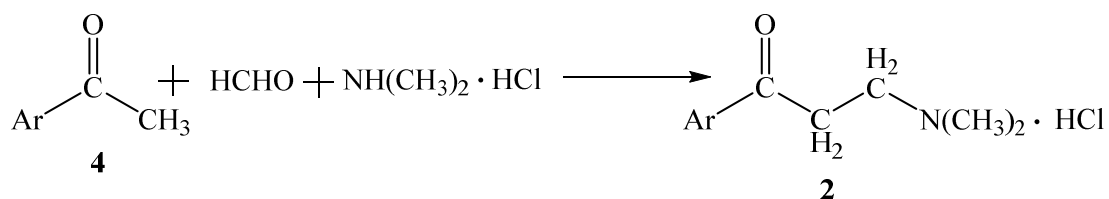
СИНТЕЗ ЗАМЕЩЁННЫХ БЕНЗО[*b*]ФУРАНОВ

В последнее время возрастает интерес к соединениям, содержащим в своей структуре бензо[*b*]фурановый фрагмент. Это связано с обилием возможностей применения бензо[*b*]фурановых производных: в качестве биологически активных соединений, проявляющих противораковую, противогрибковую активность, а также в качестве фрагментов молекул фотохромных красителей и мезоморфных соединений [1–4].

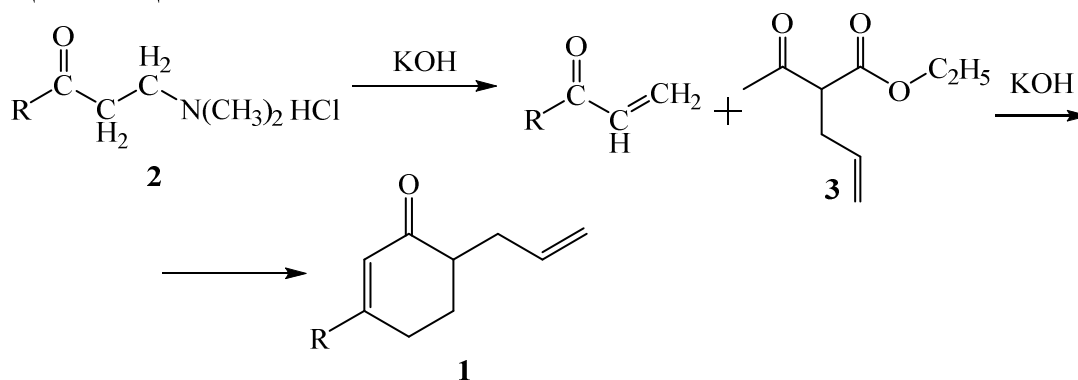
Данное исследование посвящено разработке препаративного метода синтеза 2,6-дизамещённых бензо[*b*]фуранов циклизацией аллилциклогексенонов. В качестве исходных соединений для реализации данного исследования являются 6-аллил-3-арилциклогекс-2-еноны **1**. Из рассмотрения ретросинтетической схемы последних видно, что наиболее доступным методом синтеза последних является циклизация солей Манниха **2** с аллилацетоуксусным эфиром **3**.



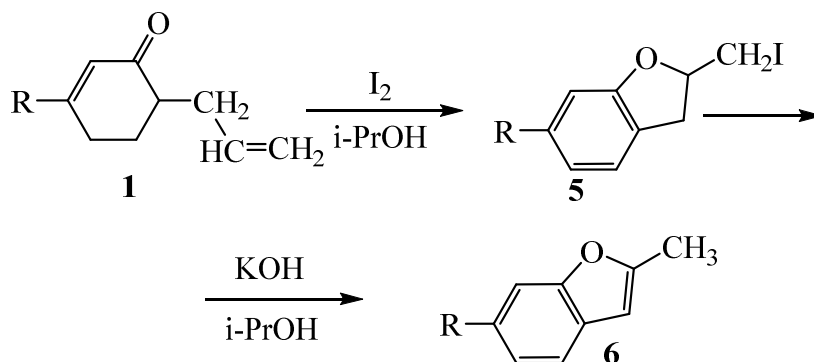
Первым шагом в синтезе исходных аллилзамещённых циклогексенонов является получение солей Манниха **3** ароматического ряда. Данные соли были синтезированы кипячением в пропан-2-оле соответствующих метиларилкетонов **4**, параформа и солянокислого диметиламина, с последующим отделением кристаллических солей. Выходы солей составили 80–96 %.



Для получения целевых аллилзамещённых циклогексенонов **1** использовали конденсацию в щелочной среде аллилацетоуксусного эфира **3** и виниларилкетонов, выделяющихся в процессе реакции из соответствующих солей Манниха **2**. Выходы ключевых аллилзамещённых циклогексенонов составили 52–69 %.



Циклизацию циклогексенонов **1** проводили под действием иода в среде изопропилового спирта при комнатной температуре. Контроль за ходом реакции осуществляли методом тонкослойной хроматографии. Циклизация аллилзамещённых циклогексенонов завершалась образованием иодпроизводного **5**, строение которого доказано с помощью спектроскопии ¹H ЯМР. В спектрах ¹H ЯМР данных соединений присутствуют характерные сложные мультиплеты в областях 5,2–4,9 м.д. и 3,6–3,0 м.д., соответствующие сигналам протонов дигидрофуранового цикла и метиленовой группы. После исчезновения исходного циклогексенона **1** добавляли 5–7 кратный избыток едкого кали и кипятили в изопропиловом спирте до исчезновения иодпроизводного **5**.



R = H, *n*-CH₃OC₆H₄, *n*-(*транс*-4-этилциклогексил)фенил, 6-этоксинафталин-2-ил

После окончания дегидроиодирования реакцию массу разбавляли водой, нейтрализовывали разбавленным раствором соляной кислоты, отфильтровывали выпавший осадок и водную фазу экстрагировали эфиром. Продукт перекристаллизовывали из изопропилового спирта. Выходы полученных бензо[*b*]фуранов представлены в таблице. Строение всех синтезированных соединений подтверждено методом спектроскопии ¹H ЯМР. В спектрах целевых бензо[*b*]фуранов исчезают характерные мультиплеты дигидрофуранового цикла и метиленовой группы и появляются сигналы протона в положении 3 бензофурановой системы при 6,4–6,35 м.д., а также сигнал протонов метильной группы фуранового цикла при 2,46 м.д.

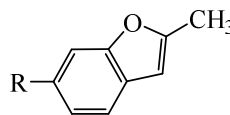
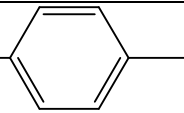
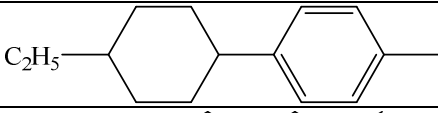
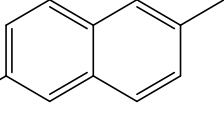


Таблица – Выходы целевых бензо[*b*]фуранов

R	Выход, %
H	89
H ₃ CO- 	88
C ₂ H ₅ - 	95
C ₂ H ₅ O- 	80

Таким образом, на данном этапе исследования нами разработан удобный метод трансформации аллилзамещённых циклогексенонов в замещённые бензо[*b*]фураны с препаративными выходами и применением доступных реагентов.

ЛИТЕРАТУРА

1. Synthesis and antifungal activity of 1,2,3-triazole containing fluconazole analogues / N. Aher [et.al.] // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* – 2009. – Vol. 19, № 3. – P. 759–763.
2. Synthesis of 1,2,3-triazole-linked pyrrolobenzodiazepine conjugates employing «click» chemistry: DNA-binding affinity and anticancer activity / A. Kamal [et.al.] // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* – 2009.– Vol. 18, № 4. – P. 1468–1473.
3. Preparation and reactions of sugar azides with alkynes: synthesis of sugar triazoles as antitubercular agents / B. Singh [et.al.] // *Carbohydr. Res.* – 2008.– Vol. 343, № 7. – P. 1153–1162.
4. *Organic Photochromic and Thermochromic Compounds* / ed. by J. C. Crano, R. J. Guglielmetti // New York: Kluwer Academic Publishers. – 2002. – Volume 2. – 465 p.

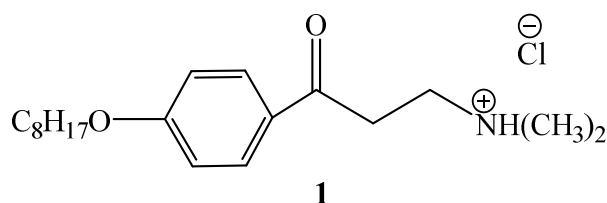
УДК 547.554+547.572

Студ. Н.А. Маргалик, магистрант А.С. Орёл
Науч. рук.: зав. кафедрой, доц. С.Г. Михалёнок;
проф. В. С. Безбородов
(кафедра органической химии, БГТУ)

СИНТЕЗ СОЛЕЙ МАННИХА АЦЕТОФЕНОНОВОГО ТИПА

Соли Манниха – представляют собой большой практический интерес, что позволяет использовать эти соединения для получения широкого спектра веществ, проявляющих жидкокристаллические свойства и обладающие биологической активностью. Это позволяет использовать соединения данного типа для получения ряда лекарственных препаратов с антимикробными, противогрибковыми, противораковыми, болеутоляющими, противотуберкулезными и многими другими свойствами [1].

Целью данной работы являлся синтез соли Манниха ацетофенонового типа **1** – основного промежуточного соединения при получении жидкокристаллических и биологически активных веществ.



Ниже представлен один из способов получения веществ терфенилового ряда, обладающих жидкокристаллическими свойствами, на