

НОВИЙ ПІДХІД ДО СИНТЕЗУ ПОХІДНИХ 1,3,4,7-ТЕТРАГІДРО-2H-1,4-ДІАЗЕПІН-2-ОНУ

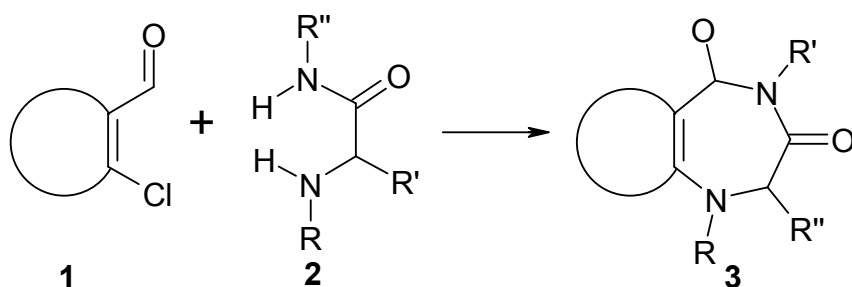
Артеменко А.М.,¹ Остапчук Є.М.,² Рябухін С.В.,^{1,2} Комаров І.В.¹

¹ Київський національний університет імені Тараса Шевченка

² ТОВ НВП "Єнамін"

Відомо, що сполуки діазепінового ряду проявляють біологічну активність та широко використовуються в якості різноманітних лікарських засобів. Однак їх використання обмежено важкодоступністю цих сполук. Існує небагато методів утворення цієї гетероциклічної системи.

Нами був розроблений принципово новий підхід до синтезу системи 1,3,4,7-тетрагідро-2H-1,4-діазепін-2-ону. Виходячи з відповідних хлоральдегідів (1) та амідів α -амінокислот (2) в умовах реакції арилювання (K_2CO_3/DMF або $DIPEA/MeCN$) нами були отримані з високими виходами відповідні 7-гідрокси-1,3,4,7-тетрагідро-2H-1,4-діазепін-2-они (3):

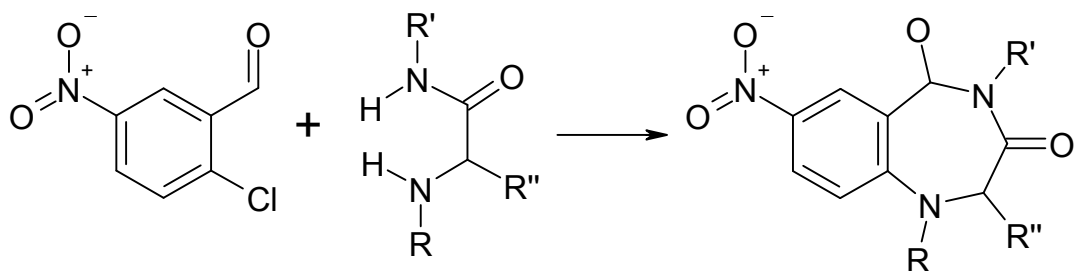


a) RR' - $(CH_2)_3$, R'' - H, $n-C_3H_7$

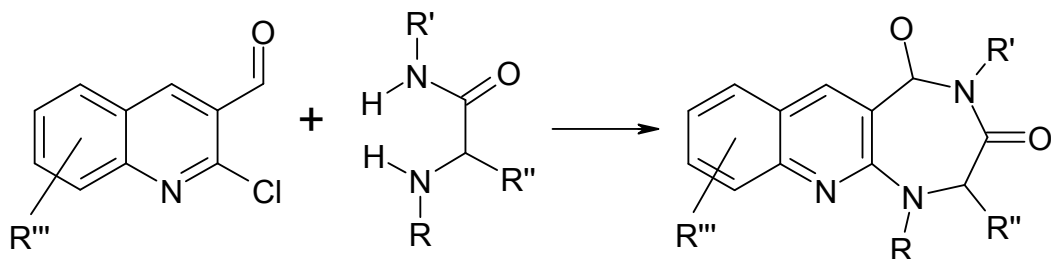
b) RR' - $CH_2CHONHCH_2$, R'' - H

c) R - H, R' - $sec-C_4H_9$, R'' - H

Утворення системи 1,3,4,7-тетрагідро-2H-1,4-діазепін-2-ону відбувається як в ряду ароматичних хлоральдегідів,



так і в ряду похідних хіноліну



R''' - H, 8- CH_3 , 7- OCH_3 , 7- CH_3 , 6- OCH_3 , 6- CH_3