

ЦИКЛІЗАЦІЯ ПРОДУКТІВ АРИЛЮВАННЯ 2-АЦЕТИЛФУРАНУ І ПРОСЛИЗЕВОЇ КИСЛОТИ

Литвин Р.З., Горак Ю.І., Матійчук В.С.

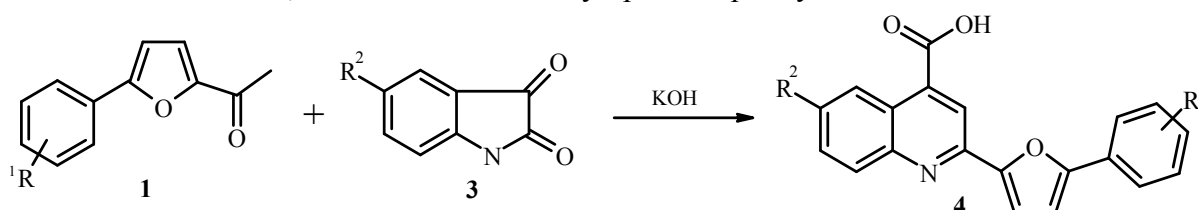
Львівський національний університет імені Івана Франка
matichyk@mail.lviv.ua

Інтерес до реакції арилювання фуранових сполук зумовлений передусім тим, що вона використовується для синтезу біологічно активних речовин, серед яких є лікарські засоби. Спеціалісти з медичної та фармацевтичної хімії цікавляться, крім давно відомих нітрофуранових сполук, похідними арилфурану. Відомо, що арилфуранові структурні фрагменти входять до складу природних речовин та сполук, які виявляють біологічну активність.

Мета нашої роботи – дослідити арилювання ацетилфурану та фуран-2-карбоної (прослизевої) кислоти і циклізації отриманих сполук.

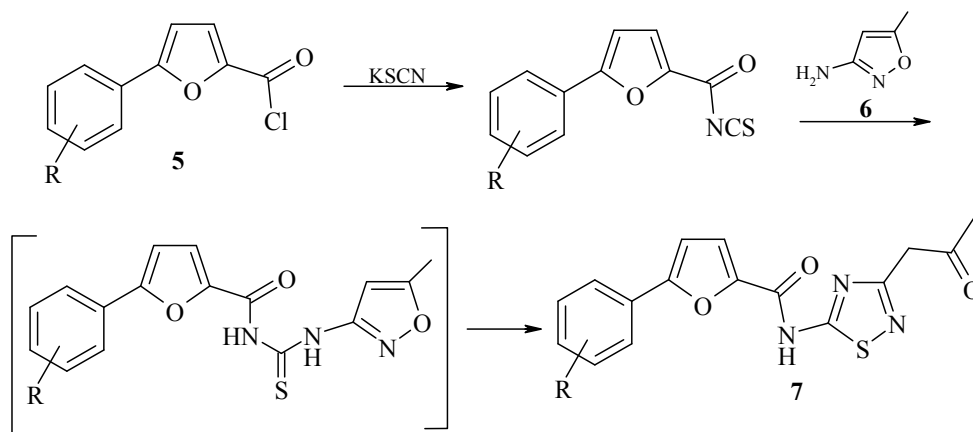
Взаємодією ацетилфурану та фуран-2-карбоної кислоти з арендіазонієвими солями в присутності CuCl_2 одержано 2-арил-5-ацетилфурану **1** та 2-арилфуран-5-карбоної кислоти **2**.

Кетон **1** вивчений у реакції циклізації з ізатином і його похідними **3**. В результаті рециклізації формується піридиновий цикл і з хорошими виходами отримуються похідні цинхонінової кислоти **4**, які виявляють високу протимікробну активність.



Оскільки кислоти **4** виявились перспективними для практики, ми дослідили деякі перетворення за їх участю, зокрема такі, що супроводжуються утворенням нових фармакофорних груп. При взаємодії з аміомеркаптотриазолами формується конденсована система триазоло[3,4-*b*]тіадіазолу. Досліджено також гетероциклізації з 2-арилфуран-5- ω -бромацетофенонами. Зокрема, при їх взаємодії з аміомеркаптотриазолами утворюється тіазиновий цикл.

Використовуючи кислоти **2** і відповідні хлорангідриди **5**, ми застосували їх для конструювання 1,2,4-тіадіазольного циклу. Спочатку одержували ацилізотіоціанати які *in situ* вводили в реакцію з 3-аміно-5-метилізоксазолом **6**. З'ясувалося, що продукти нуклеофільного приєднання – ацилітіосечовини є лише інтермедіатами цієї взаємодії. В умовах реакції відбувається рециклізація: руйнується ізоксазольний цикл і формується 1,2,4-тіадіазольний (сполуки **7**).



Будову одержаних сполук підтверджували даними ЯМР ^1H спектроскопії.