СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ НОВИХ ПОХІДНИХ БЕНЗОФУРАНУ

Пліхта А.М.
Чернівецький національний університет імені Юрія Федьковича
plihta@mail.ru

Похідні бензофурану являють інтерес для тонкого органічного синтезу як кінцеві продукти і як потенціальні фізіологічно активні сполуки. Ядро бензофурану входить до складу деяких природних сполук – уснинової кислоти, що міститься у лишаях, ейпарину, який виділяють із кореня рослин. Відомі фурановмісні високоефективні антимікробні препарати – фурацилін, фуразолін, фуразолідон; серед похідних бензофурану також є ефективні лікарські препарати – анестетик бензофурокаїн, спазмолітик бензарон та ін.

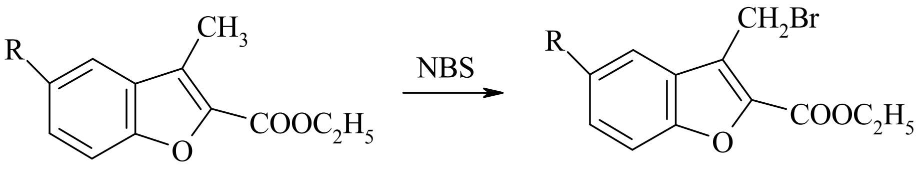
Відомі також біологічно активні речовини серед фосфонієвих та амонієвих сполук.

Поєднання бензофуранового та онієвих фрагментів у молекулі може призвести до одержання речовин з цікавими властивостями.

Метою роботи є синтез та дослідження біологічної активності нових похідних бензофурану.

Взаємодією хлорацетооцтового естеру з фенолом, п-бромфенолом, п-метоксифенолом нами синтезовані 2-етоксикарбоніл-3-метилбензофуран (I), 5-бром-2-етоксикарбоніл-3-метилбензофуран (II), 2-етоксикарбоніл-5-метокси-3-метилбензофуран (III).

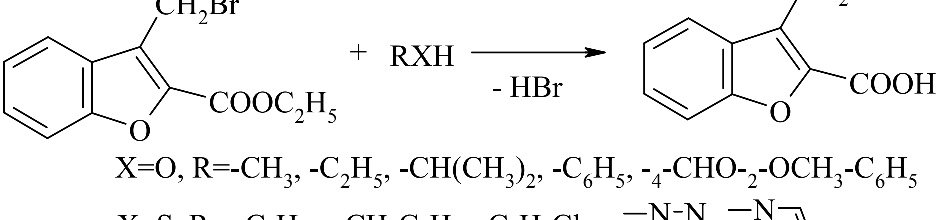
Нами розроблено методики бромування синтезованих метилпохідних бензофурану бромсукцінимідом при освітленні в розплаві при температурі 130°С.



I-III IV-VI

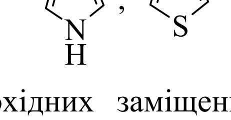
R= -H (I, IV), $-OCH_3$ (II, V), Br (III, VI)

З метою розширення спектра похідних бензофурану нами вивчені реакції 3-бромометил-2-етоксикарбонілбензофурану (IV) зі спиртами, фенолами та меркаптанами з аліфатичними, ароматичними та гетероциклічними замісниками. В результаті синтезовані сполуки, що містять у 3-му положенні бензофуранового ядра заміщені окси- та меркаптогрупи.



X=O, R=$-CH_3$, $-C_2H_5$, $-CH(CH_3)_2$, $-C_6H_5$, $-_4-CHO-_2-OCH_3-C_6H_5$

X=S, R= $-C_6H_{11}$, $-CH_2C_6H_5$, $-C_6H_4Cl$,



На основі реакції одержаних бромометильних похідних заміщених бензофуранів з трифенілфосфіном синтезовані відповідні четвертинні фосфонієві похідні бензофурану.

Бензофуранфосфонієві солі досліджені на предмет антимікробної активності. Встановлено, що вони проявляють виражену активність відносно S. Aureus і B. Subtilis. Їх мінімальні інгібуючі концентрації складають 31,2 і 15,6 мкг/мл відповідно.