

ПРОДУКТИ АРИЛЮВАННЯ 2,5(2,6)-ДИБРОМ-1,4-БЕНЗОХІНОНІВ АРЕНДІАЗОНІЄВИМИ СОЛЯМИ У СИНТЕЗІ ПОХІДНИХ БЕНЗОКСАТІОЛУ

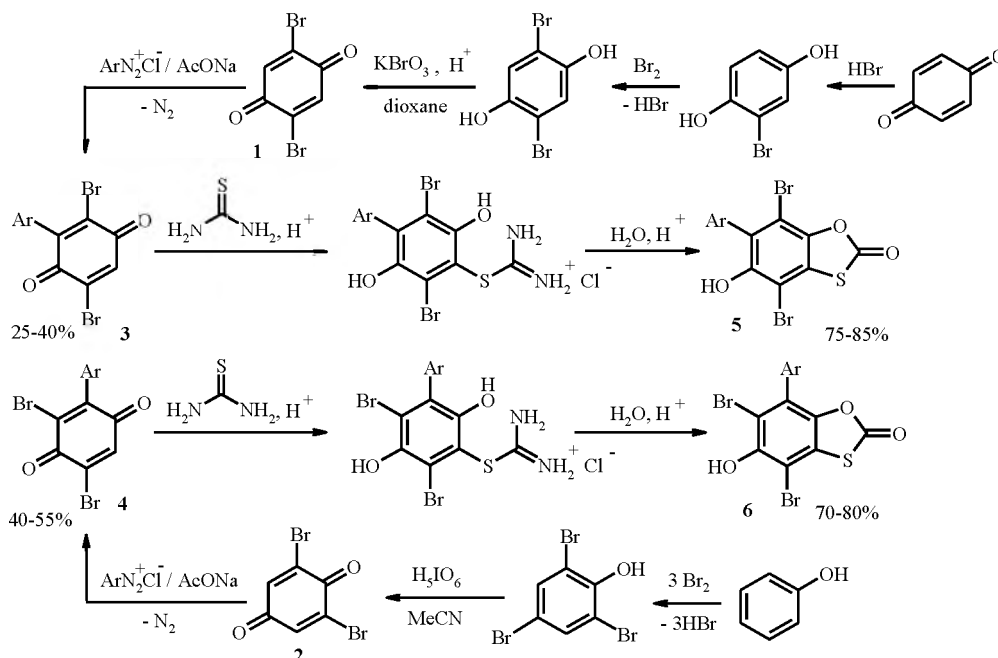
Мартяк Р.Л., Приступа О.С., Обушак М.Д.

Львівський національний університет імені Івана Франка, Львів, Україна

roman.martyak@lmu.edu.ua

Одним з перспективних напрямків застосування 1,4-хінонів в органічному синтезі є отримання різноманітних гетероциклічних систем на їх основі. Ряд гетероциклів, що містять конденсовані з бензеновим кільцем п'ятичленні цикли, є відомими біологічно активними сполуками. Зокрема, 1,3-бензоксатіол-2-они та їхні похідні – важливі фармакофори з багатогранною фармакологічною активністю: антибактеріальною, протизапальною, протигрибковою, антиоксидантною. Вони виявляють цитостатичні, антипсоріатичні, протівірусні, радіопротекторні властивості; їх застосовують також у косметології [1].

Розроблені за останні роки нові способи прямої С–Н функціоналізації хінонів арильними фрагментами вимагають використання дорогих каталізаторів, токсичних розчинників чи важкодоступних реагентів. Разом з тим, достатньо зручним способом арилювання 1,4-бензохінону та його похідних є реакція Меєрвейна [2]. Ми дослідили реакційну здатність деяких дибромозаміщених 1,4-бензохінонів у реакції арилювання ароматичними діазосолями. Вихідні 2,5- та 2,6-дибром-1,4-бензохінони **1**, **2** отримували окисненням продуктів бромовання відповідних фенолів. Встановлено, що дибромохінони **1**, **2** легко арилюються арендіазонієвими солями у водній мурашиній кислоті, утворюючи 3-арил-2,5(2,6)-дибром-1,4-бензохінони **3**, **4**. Проведені дослідження показали, що хінони **3**, **4** реагують з тіокарбамідом за кімнатної температури в кислому середовищі, утворюючи відповідні ізотіуронієві солі, які під час нагрівання циклізуються, і з високими виходами утворюють дибромозаміщені 6(7)-арил-5-гідрокси-1,3-бензоксатіол-2-они **5**, **6**. Будову синтезованих сполук підтверджено даними спектроскопії ^1H - та ^{13}C ЯМР.



Робота частково підтримана фондом Simons Foundation (Award No 1037973) та Міністерством освіти і науки України.

1. Vellasco W.T., Gomes C.R.B., Vasconcelos T.R.A. Chemistry and biological activities of 1,3-benzoxathiol-2-ones // *Mini. Rev. Org. Chem.* – 2011. – 8, No. 1. – P. 103–109.

2. Wang Y., Zhu S., Zou L.-H. Recent advances in direct functionalization of quinones // *Eur. J. Org. Chem.* – 2019. – No.12. – P. 2179–2201.