

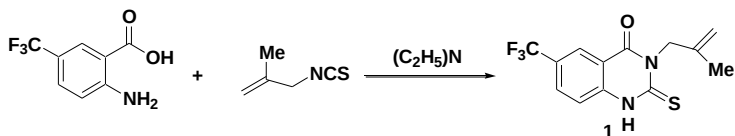
РЕГІОСЕЛЕКТИВНА ЕЛЕКТРОФІЛЬНА ЦИКЛІЗАЦІЯ CF₃-ЗАМІЩЕНОГО 3-МЕТАЛІЛ-2-ТІОКСОХІНАЗОЛІН-4-ОНУ

Кут М. М., Кут Д. Ж., Онисько М. Ю., Балог І. М., Лендел В. Г.

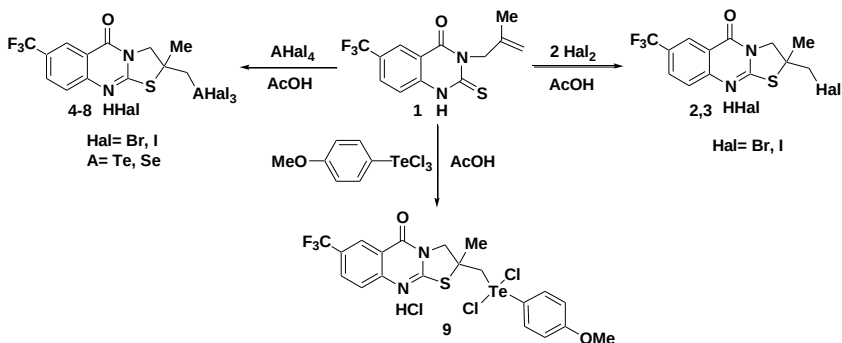
ДВНЗ «Ужгородський національний університет», м. Ужгород, Україна
kutmykola@ukr.net

Заміщені хіназоліни та їхні конденсовані аналоги є перспективними об'єктами для дизайну біологічно активних сполук як прототипів інноваційних лікарських засобів. Це зумовлено тим, що хіназоліновий фрагмент є структурним елементом багатьох природних алкалоїдів, такі як фебрифугін, глікорин, арборин, глікозмінін та пеганін. Перспективним методом синтезу конденсованих похідних хіназоліну є електрофільна внутрішньомолекулярна гетероциклізація, потенціал якої на сьогоднішній день повністю не розкритий. Дана робота присвячена дослідженню процесу електрофільної циклізації CF₃-заміщеного 3-металілхіназолін-4-ону різними галогеновмісними електрофільними реагентами.

В якості модельного об'єкту використано 3-металіл-2-тіоксо-6-трифторометил-2,3-дигідрохіназолін-4(1H)-он **1**. Нагріванням CF₃-заміщеної антранілової кислоти з металіт ізотіоціанатом в середовищі триетиламіну отримано хіназолон **1**.



Металільний 2-тіоксохіназолон **1** має декілька нуклеофільних центрів для атаки електрофільних реагентів, а саме, кратний зв'язок, екзоциклічні атоми оксигену та сульфору. Для дослідження регіохімії процесу електрофільної внутрішньомолекулярної циклізації тіон **1** піддали дії різними електрофільними реагентами – галогенами, халькогентетрагалогенідами та *п*-метоксифенілтелуртрихлоридом. Встановлено, що, незалежно від природи галогеновмісного електрофільного реагента, в результаті взаємодії відбувається регіоселективне анелювання тіазолонового циклу до остову хіназолінового фрагмента з утворенням трициклічних лінійних структур **2–9**.



Таким чином, в результаті даної роботи досліджено регіохімію електрофільної циклізації CF₃-заміщеного хіназоліну під дією різних галогеновмісних електрофільних реагентів та отримано потенційно біологічно активні халькогеновмісні тіазолохіназолінієві солі лінійної будови.