

**ПРОТОН-ІНДУКОВАНА ЦИКЛІЗАЦІЯ N-АЛКЕНІЛЬНИХ  
4-ОКСОХІНАЗОЛІН-2-ТІОНІВ**

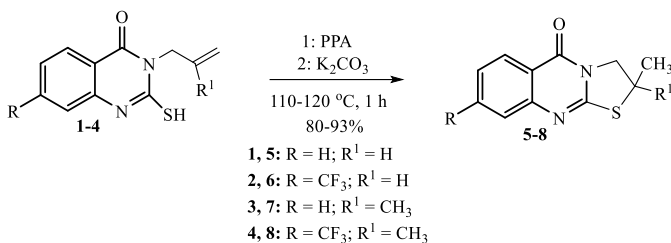
*Кум Д. Ж., Кут М. М., Онисько М. Ю.*

ДВНЗ «Ужгородський національний університет», Ужгород, Україна  
dianabereksazi@gmail.com

Конденсовані похідні хіназоліну є цікавими об'єктами для досліджень в медичній хімії. Відомо, що вони проявляють широкий спектр біологічної активності. Ефективним та перспективним методом одержання конденсованих хіназолінів є електрофільна внутрішньомолекулярна циклізація (ЕВЦ) їх N(S)-ненасичених похідних. Використовуючи даний метод цілеспрямованого синтезу, можливе анелювання п'яти або шестичленного циклу до остова хіназоліну. Регіохімія процесу електрофільної внутрішньомолекулярної циклізації залежить від природи електрофільного реагенту, полярності розчинника, умов проведення реакції та структурних особливостей субстрату чи електрофілу. Метою даної роботи є дослідження регіохімії процесу протон-індукованої циклізації N(3)-алкенільних похідних хіназолін-4-ону під дією поліфосфорної кислоти (ПФК).

Об'єктами дослідження процесу електрофільної циклізації ПФК є 3-аліл(металіл)-4-оксохіназолін-2-тіони **1-4**. Дані субстрати цікаві тим, що містять декілька додаткових нуклеофільних центрів для проходження ЕВЦ: кратний C=C зв'язок алкенільного фрагменту та ендациклічний атом Сульфуру й Оксигену. За рахунок наявності наведених структурних особливостей можна очікувати анелювання як оксазольного так і тіазольного циклу.

Реакцію гетероциклізації 4-оксохіназолін-2-тіонів **1-4** надлишком ПФК проводили при нагріванні (110–120 °C) та постійному перемішуванні реакційної суміші. Надлишок ПФК нейтралізували насиченим розчином карбонату калію. Встановлено, що реакції ЕВЦ досліджуваних об'єктів відбуваються регіоселективно із залученням нуклеофільного центру – ендациклічного атома Сульфуру з анелюванням тіазольного циклу. В результаті утворюються гетероцикли лінійної будови **5-8**. Доказом утворення саме лінійних тіазолохіназолінів слугують дані ІЧ- та ЯМР-спектроскопії.



Таким чином, протон-індукована циклізація 3-аліл(металіл)-4-оксохіназолін-2-тіонів відбувається регіоселективно з утворенням хіназолінів лінійної будови незалежно від наявності та виду замісників в алільному фрагменті та положенні 7 хіназоліну.