

Синтез циклопропилзамещенных 4Н-3,1-бензоксазинов на основе 1,4-бензодиоксана и 1,2-диметоксибензола

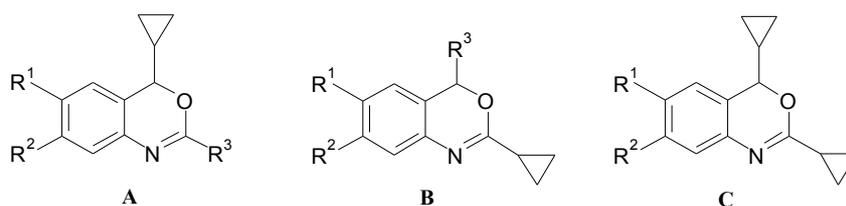
Хасанов Махмут Ильдусович, Мочалов Сергей Сергеевич

аспирант

Московский Государственный Университет им. М. В. Ломоносова, Химический факультет, Москва, Россия

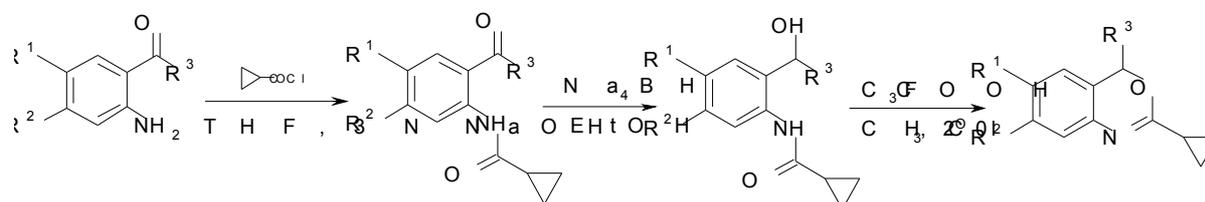
khassanoff@yandex.ru

Теоретический анализ биологической активности (осуществленный с использованием программы PASS) гипотетических структур циклопропилзамещенных 4Н-3,1-бензоксазинов (типа А - С), содержащих в бензольном кольце этилендиоксифрагмент ($R^1-R^2 = OCH_2CH_2O$) либо метоксигруппы ($R^1 = R^2 = OCH_3$), предсказывает высокую вероятность проявления ими свойств антагонистов ГАМК_A-рецепторов, антагонистов бензодиазепаина, психотропной и седативной активности при низкой токсичности.



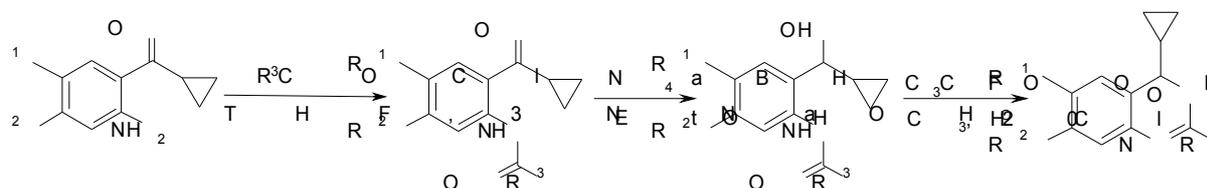
Вместе с тем, при изучении литературных данных по методам синтеза 4Н-3,1-бензоксазинов, выяснилось, что не было синтезировано ни одно из соединений указанного типа (А - С).

Нам удалось показать, что, используя специфическую реакционную способность 1,4-бензодиоксана и 1,2-диметоксибензола, можно осуществить синтез все трех типов циклопропилзамещенных 4Н-3,1-бензоксазинов.



$R^1-R^2 = OCH_2CH_2O$; $R^3 = Ph$ (1), $n-BrC_6H_4$ (2), $n-CH_3OC_6H_4$ (3)

$R^1 = R^2 = OCH_3$; $R^3 =$ (4)



$R^1-R^2 = OCH_2CH_2O$; $R^3 = m-FC_6H_4$ (5)

$R^1 = R^2 = OCH_3$; $R^3 =$ (6)

Таким образом, разработан общий метод синтеза циклопропилзамещенных 4Н-3,1-бензоксазинов. Структура всех впервые синтезированных бензоксазинов 1 - 6, также как и их предшественников, подтверждено данными ЯМР¹H спектроскопии, масс-спектрометрии и данными элементного анализа.