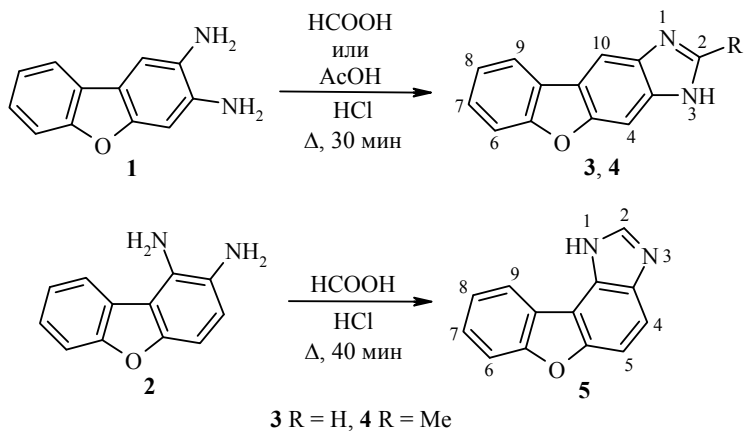


## СИНТЕЗ НОВЫХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СИСТЕМ – БЕНЗО[*b*]ФУРОБЕНЗИМИДАЗОЛОВ

**Ключевые слова:** 1*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*g*]-, 3*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*f*]бензимидазол.

Целью настоящей работы было создание тетрациклических конденсированных систем, включающих два бициклических фрагмента – бензо[*b*]фуран и бензимидазол, каждый из которых в отдельности характеризуется высокой фармакологической активностью. Идея такого размещения фрагментов обоснована высокой активностью производных имидазола. Дибазол, антибиотик азомидин, 2-нитроимидазол, аминокислота гистидин [1, 2] – неполный перечень лекарственных средств, внедрённых в медицинскую практику. В качестве исходных соединений нами были выбраны 2,3- (**1**) и 3,4-диаминобензофураны (**2**) [3]. Циклизацию проводили в условиях модифицирован-



ной реакции Филлипса [4–6]. В качестве циклизующего агента использовали муравьиную и уксусную кислоты с добавлением каталитического количества конц. HCl.

В результате были синтезированы 3*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*f*]- (3), 2-метил-3*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*f*]- (4) и 1*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*g*]бензимидазолы (5).

Структура полученных соединений установлена ИК и ЯМР <sup>1</sup>H спектроскопией.

ИК спектры записаны на спектрометре Thermo Nicolet Avatar 370. Спектры ЯМР <sup>1</sup>H зарегистрированы на спектрометре Bruker WM-400 (400 МГц) в ДМСО-*d*<sub>6</sub>, внутренний стандарт ТМС. Элементный анализ выполнен на анализаторе HP-165B CHN. Температуры плавления определены на аппарате Mel-Temp 30. Контроль за ходом реакций и чистотой полученных соединений проводили методом ТСХ на пластинках Silufol UV-254 (элюент C<sub>6</sub>H<sub>6</sub>–EtOAc–Et<sub>2</sub>O, 1:3:5).

**3*H*-Бензо[*b*]фуоро[3,2-*f*]бензимидазол (3).** Смесь 0.20 г (1 ммоль) 2,3-диаминодибензофурана (1), 2.0 мл HCOOH и 0.5 мл конц. HCl кипятят 30 мин. Реакционную смесь осторожно подщелачивают при энергичном перемешивании и охлаждении, добавляя разбавленный раствор NH<sub>4</sub>OH до появления слабого запаха аммиака. Выпавший желтовато-коричневый осадок отфильтровывают, тщательно промывают ледяной водой (4 × 25 мл) и сушат. Выход 0.18 г (85%). Т. пл. 191–195 °С. ИК спектр (тонкий слой), ν, см<sup>-1</sup>: 3470 (NH), 1619 (имидазольное кольцо). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (*J*, Гц): 7.31–8.03 (4H, м, H-6,7,8,9); 8.06 (1H, д, *J*<sub>10,4</sub> = 0.6, H-10); 8.10 (1H, с, H-2); 8.20 (1H, д, *J*<sub>4,10</sub> = 0.6, H-4); 12.10 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: С 74.95; Н 3.88; N 13.43. С<sub>13</sub>H<sub>8</sub>N<sub>2</sub>O. Вычислено, %: С 74.99; Н 3.87; N 13.45.

**2-Метил-3*H*-бензо[*b*]фуоро[3,2-*f*]бензимидазол (4).** Получен аналогично вышеуказанному методу. Циклизацию проводили в уксусной кислоте. Выход 0.18 г (82%). Т. пл. 249–251 °С. ИК спектр (тонкий слой), ν, см<sup>-1</sup>: 3468 (NH), 2850 (CH<sub>3</sub>), 1619 (имидазольное кольцо). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (*J*, Гц): 2.58 (3H, с, CH<sub>3</sub>); 7.33–8.03 (4H, м, H-6,7,8,9); 8.24 (1H, д, *J*<sub>4,10</sub> = 0.6, H-4); 8.86 (1H, д, *J*<sub>10,4</sub> = 0.6, H-10); 12.08 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: С 75.63; Н 4.51; N 12.63. С<sub>14</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O. Вычислено, %: С 75.66; Н 4.54; N 12.60.

**1*H*-Бензо[*b*]фуоро[3,2-*g*]бензимидазол (5).** Смесь 0.20 г (1 ммоль) 3,4-диаминодибензофурана (2), 2.0 мл HCOOH и 0.5 мл конц. HCl кипятят 40 мин. Реакционная смесь становится коричнево-прозрачной. Смесь осторожно подщелачивают при энергичном перемешивании и охлаждении, добавляя разбавленный раствор NH<sub>4</sub>OH до появления слабого запаха аммиака. Выпавший коричневый осадок отфильтровывают, тщательно промывают ледяной водой (4 × 25 мл) и сушат. Выход 0.17 г (80%). Т. пл. 161–164 °С. ИК спектр (тонкий слой), ν, см<sup>-1</sup>: 3440 (NH), 1610 (имидазольное кольцо). Спектр ЯМР <sup>1</sup>H, δ, м. д. (*J*, Гц): 7.31–8.04 (4H, м, H-6,7,8,9); 7.72 (1H, д, *J*<sub>5,4</sub> = 8.9, H-5); 7.92 (1H, д, *J*<sub>4,5</sub> = 8.9, H-4); 8.26 (1H, с, H-2); 12.40 (1H, уш. с, NH). Найдено, %: С 74.97; Н 3.86; N 13.46. С<sub>13</sub>H<sub>8</sub>N<sub>2</sub>O. Вычислено, %: С 74.99; Н 3.88; N 13.45.

## СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. М. Д. Машковский, *Лекарственные средства*, Медицина, Москва, 1993, ч. 2, с. 114.
2. А. Т. Солдатенко, Н. М. Колядина, Н. В. Шендрик, *Основы органической химии лекарственных веществ*, Химия, Москва, 2001, с. 87, 105.
3. Н. Gilman, G. R. Wilder, *J. Am. Chem. Soc.*, **76**, 2906 (1954).
4. А. Ф. Пожарский, В. А. Анисимова, Е. Б. Цупак, *Практические работы по химии гетероциклов*, Изд-во. Рост. ун-та, Ростов н/Д, 1988, с. 78.

5. Р. Эльдерфилд, *Гетероциклические соединения*, Изд-во иностр. лит., Москва, 1961, т. 5, с. 161.
6. М. Maisuradze, N. Gaxokidze, S. Tsqvitaia, *J. Chem. Chem. Eng.*, **6**, 484 (2012).

**М. Г. Маисурадзе\*, В. О. Ананишвили, Н. З. Гахокидзе,  
М. М. Матнадзе, С. П. Цквитаия**

*Грузинский технический университет,  
ул. Костава, 77, Тбилиси 0175, Грузия  
e-mail: m\_maisuradze@gtu.ge*

*Поступило 1.04.2011*

ХГС. – 2012. – С. 1204

---