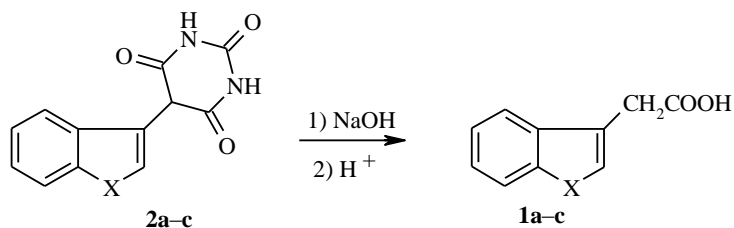


ПИСЬМА В РЕДАКЦИЮ

НОВЫЙ МЕТОД СИНТЕЗА БЕНЗО[*b*]ФУРАН-, БЕНЗО[*b*]ТИОФЕН- И БЕНЗО[*b*]СЕЛЕНОФЕН-3-УКСУСНЫХ КИСЛОТ

Ключевые слова: бензо[*b*]фуран-, бензо[*b*]тиофен-, бензо[*b*]селенофен-3-уксусные кислоты, новый синтез.

Гетерилуксусные кислоты представляют интерес в качестве потенциальных биологически активных соединений и реагентов для тонкого органического синтеза. Бензо[*b*]фуран-3-уксусная кислота (**1a**) и бензо[*b*]тиофен-3-уксусная кислота (**1b**) обладают свойствами стимуляторов роста растений. Недавно было обнаружено, что по ауксиноподобной активности бензо[*b*]селенофен-3-уксусная кислота (**1c**) превосходит индолил-3-уксусную кислоту [1, 2]. Если методы синтеза кислот **1a,b** хорошо отработаны, то бензо[*b*]селенофен-3-уксусная кислота труднодоступна. Единственный способ ее получения описан в работе [3].



1, 2 a X = O, **b** X = S, **c** X = Se

Нами предложен новый метод синтеза бензо[*b*]фуран-, бензо[*b*]тиофен- и бензо[*b*]селенофен-3-уксусных кислот (**1a-c**), представляющий собой щелочной гидролиз соответствующих 5-(3-гетерил)гексагидропиримидин-2,4,6-трионов (**2a-c**). Последние получены конденсацией бензо[*b*]фуран-3[2H]-она, бензо[*b*]тиофен-3[2H]-она и бензо[*b*]селенофен-3[2H]-она с барбитуровой кислотой по методу [4, 5]. По данным спектров ЯМР ¹H, соединения **2a-c** в растворе ДМСО-*d*₆ содержат около 65% кетоформы, о чем свидетельствуют сигналы в области 5.37–5.50 м. д., принадлежащие протонам 5-Н.

5-(3-Бензо[*b*]фурил)гексагидропиримидин-2,4,6-трион (2a). Выход 92%. Т. пл. 229–230 °С (из уксусной кислоты). Спектр ЯМР ¹H (200 МГц), δ, м. д. (*J*, Гц): 5.40 (1H, с, 5-Н); 7.29 (1H, т, *J* = 7.2, 6-Н); 7.38 (1H, т, *J* = 7.7, 5-Н аром.); 7.49 (1H, д, *J* = 7.2, 7-Н); 7.65 (1H, д, *J* = 7.7, 4-Н); 7.95 (1H, с, 2-Н); 10.90 (2H, уш. с, NH); 11.56 (1H, уш. с, OH енола). Найдено, %: С 59.31; Н 3.48; N 11.40. С₁₂H₈N₂O₄. Вычислено, %: С 59.02; Н 3.30; N 11.47.

5-(3-Бензо[*b*]тиенил)гексагидропиримидин-2,4,6-трион (2b). Выход 91%. Т. пл. 260 °С (из уксусной кислоты). Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д.: 5.50 (1H, с, 5-Н); 7.30–8.00 (5H, м, Н аром.); 10.90 (2H, уш. с, NH); 11.51 (1H, уш. с, OH енола). Найдено, %: С 55.61; Н 3.24; N 10.60; S 12.40. С₁₂H₈N₂O₃S. Вычислено, %: С 55.38; Н 3.10; N 10.76; S 12.32.

5-(Бензо[*b*]селенофен-3-ил)гексагидропиримидин-2,4,6-трион (2c). Выход 91%. Т. пл. 157–158 °С (из уксусной кислоты). Спектр ЯМР ¹H, δ, м. д.: 5.37 (1H, с, 5-Н); 7.20–7.56 (3H, м, 5-, 6-, 7-Н аром.); 7.90 (1H, с, 2-Н); 8.00 (1H, м, 4-Н); 10.83 (2H, уш. с, NH); 11.45 (1H, уш. с, OH енола). Найдено, %: С 46.75; Н 2.35; N 9.35; Se 25.54. С₁₂H₈N₂OSe. Вычислено, %: С 46.92; Н 2.63; N 9.12; Se 25.71.

Бензо[*b*]фуран-3-уксусная кислота (1a). Выход 68%. Т. пл. 89 °С (из гептана) (т. пл.

89 °C [6]). Найдено, %: С 68.36; Н 4.42. С₁₀Н₈О₃. Вычислено, %: С 68.18; Н 4.58.

Бензо[*b*]тиофен-3-уксусная кислота (1b). Выход 66%. Т. пл. 108–109 °C (из гептана) (т. пл. 108–109 °C [7]). Найдено, %: С 62.23; Н 4.27; S 16.53. С₁₀Н₈О₂S. Вычислено, %: С 62.48; Н 4.19; S 16.68.

Бензо[*b*]селенофен-3-уксусная кислота (1c). Выход 58%. Т. пл. 149–150 °C (из циклогексана) (т. пл. 150 °C [3]). Спектр ЯМР ¹H (ДМСО-*d*₆), δ, м. д. (*J*, Гц): 3.73 (2H, с, СН₂); 7.28 (1H, т, *J* = 7.3, 6-H); 7.38 (1H, т, *J* = 7.7, 5-H); 7.72 (1H, д, *J* = 7.7, 4-H); 7.90 (1H, с, 2-H); 7.94 (1H, д, *J* = 7.3, 7-H); 12.18 (1H, уш. с, СООН). Найдено, %: С 50.41; Н 3.11; Se 33.28. С₁₀Н₈О₂Se. Вычислено, %: С 50.23; Н 3.37; Se 33.02.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. M. Hofinger, T. Thorpe, V. Mireille, T. Gaspar, *Acta Physiol. Plant*, **2**, No. 4, 275 (1980).
2. T. Gaspar, *Acros Org. Acta*, **1**, No. 2, 65 (1995); *Chem. Abstr.*, **123**, 308548 (1995).
3. L. Laitem, L. Critiaens, *Bull. Soc. Chim. Fr.*, 2294 (1975).
4. С. В. Толкунов, А. И. Хижан, С. И. Симонова, Н. С. Семенов, С. Н. Лящук, *XTC*, 321 (1994).
5. В. С. Вележева, В. П. Севедин, Ю. В. Ерофеев, Н. К. Генкина, Т. А. Козик, В. В. Вампилова, Н. Н. Суворов, *XTC*, 360 (1977).
6. R. Deeshpande, M. V. Paradkar, *Synth. Commun.*, **20**, 809 (1990).
7. O. Dann, M. Kokorudz, *Chem. Ber.*, **V91**, 172 (1958).

С. В. Толкунов, А. И. Хижан

*Институт физико-органической химии
и углехимии им. Л. М. Литвиненко
НАН Украины, Донецк 83114
e-mail: tolkunov@uvika.dn.ua*

Поступило в редакцию 06.11.2002