

# СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ АРИЛИДЕНОВЫХ И ЭТИЛИДЕНОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 3Н-ФУРАН-2-ОНОВ

Камнева И.Е., Тимофеева З.Ю., Егорова А.Ю.

*Саратовский государственный университет им. Н.Г. Чернышевского*

## **Synthesis and biological activity of arylidene and ethylidene derivatives of 3H-furan-2-ones**

Kamneva I.E., Nechaeva T.V., Yegorova A.Yu.

*Saratov State University named after N.G.Chernyshevski*

Пятичленные 2-оксо N,O-гетероциклы занимают одно из центральных мест в органической химии, как в теоретическом, так и прикладном аспектах. Важнейшими факторами, стимулирующими развитие химии фуран-2-онов является высокий химический потенциал, позволяющий получать на их основе новые ряды гетероциклических соединений и практически ценные вещества. Их структурные фрагменты входят в состав природных веществ, синтетических лекарственных веществ, пестицидов и др.

Внимание к ним с позиций теоретической и экспериментальной органической химии определяется структурными особенностями – наличием гетерокольца, карбонильной группой, активированного метиленового звена, а так же тем, что на основе указанных соединений получают лекарственные препараты (антибиотики Holomycin, Althiomycin), их структурные фрагменты входят в состав природных алкалоидов, желчных пигментов.

Наличие нескольких реакционных центров делает их ценными субстратами в синтезе разнообразных али- и гетероциклических систем, позволяет направленно переходить к соединениям заданного строения.

Нами изучаются реакции конденсации 5-R-фуран-2-онов с альдегидами и кетонами в различных условиях с целью расширить ряд производных фуран-2-онов и исследовать их на биологическую активность.

С целью увеличить выход продуктов конденсации, нами изучались другие способы проведения синтеза, в частности, возможность проведения конденсации в условиях микроволнового нагрева, как эффективного источника термической активации. Используя микроволновую активацию в конденсации 4-оксобутаной кислоты с альдегидами и кетонами, мы стремились: сократить время протекания реакции; отказаться от применения уксусного ангидрида в качестве растворителя; выявить другие течения реакции.

Реакцию проводили при эквимолярном соотношении реагентов в отсутствие растворителя в бытовой СВЧ-печи в течение 10-15 минут.

В этом методе нагревание вещества происходит на молекулярном уровне, каждая молекула вещества претерпевает одинаковое тепловое воздействие, что обеспечивает равномерность прогрева реакционной смеси по всему объему и делает перспективным данный метод для органического синтеза.

В условиях микроволновой активации не наблюдается образование лактона. Вероятно, вначале происходит конденсация кетона по  $\beta$ -положению кислоты и дальнейшая гетероциклизация не наблюдается из-за невозможности образования енольной формы. Структура полученных соединений доказана с привлечением данных элементного анализа, ИК- и ЯМР  $^1\text{H}$  спектроскопии.

Учитывая перспективность исследуемых соединений в качестве потенциально биологически активных веществ, все синтезированные соединения были подвергнуты компьютерному скринингу спектра биологической активности с помощью программы прогноза спектра биологической активности PASS. Данные прогноза свидетельствуют о возможности проявления соединениями тромболитической и фибринолитической активности с вероятностью ~70%.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта Президента Российской Федерации для государственной поддержке молодых российских ученых (грант МК-2014.2005.3) и Российского Фонда Фундаментальных Исследований (грант 05-03-32196).