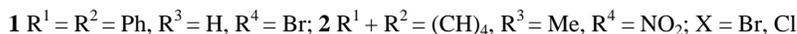
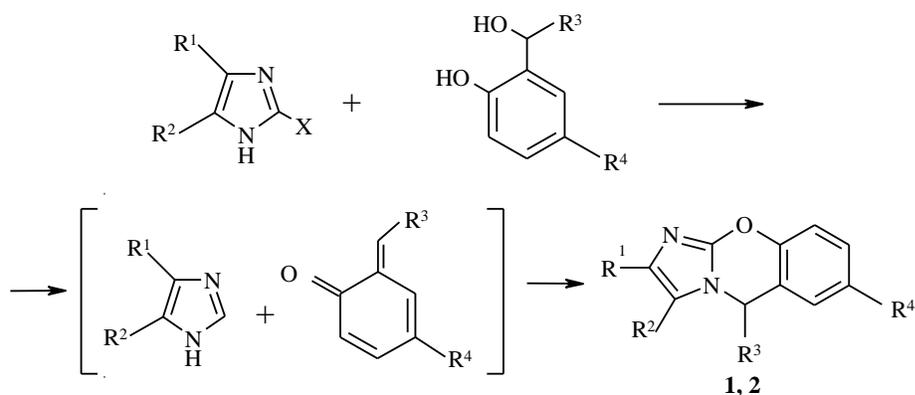


НОВЫЙ ПОДХОД К СИНТЕЗУ ИМИДАЗО[2,1-*b*][1,3]БЕНЗОКСАЗИНОВ

Ключевые слова: бензимидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазины, 2-галогенимидазолы, 2-гидроксибензиловые спирты, имидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазины.

В литературе имеются единичные указания на синтез соединений, содержащих конденсированную систему имидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазина [1, 2]. В то же время подобные соединения обладают значительной биологической активностью, в частности, противовоспалительной и антигельминтной [3, 4].

Нами предлагается простой одностадийный метод получения замещенных имидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазинов **1** и бензимидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазинов **2**, заключающийся во взаимодействии 2-галогенимидазолов или 2-галогенбензимидазолов с 2-гидроксибензиловыми спиртами в расплаве.



Реакция вероятно протекает через стадию промежуточного образования *o*-метиленихинона (*o*-хинонметид), который атакует молекулу азола с образованием конечного продукта.

7-Бром-2,3-дифенил-5Н-имидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазин (1). Смесь 1.5 г (5 ммоль) 2-бром-4,5-дифенилимидазола и 1.17 г (5.75 ммоль) 5-бром-2-гидроксибензилового спирта нагревают при 160–165 °С при интенсивном перемешивании в течение 20 мин до прекращения выделения воды. Смесь охлаждают, растворяют в метаноле, добавляют 7 мл насыщенного раствора NaOH в метаноле и выливают в воду. Выпавший осадок отфильтровывают, кристаллизуют из этанола. Получают 1.83 г (91%) продукта в виде бесцветных кристаллов с т. пл. 198–200 °С. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3059 (CH аром.), 2924, 2866 (CH_2), 1547, 1508, 1485, 1474 (C=C / C=N), 1269 (C–O–C), 1242, 775, 706 (CH аром.). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6 , 400 МГц), δ , м. д. (J , Гц): 4.99 (2H, с, CH_2); 7.14 (1H, д, $J = 8.7$, H-9); 7.22 (2H, т, $J = 7.5$, C_6H_5); 7.26 (1H, д, $J = 8.7$, H-8); 7.40 (2H, д, $J = 7.8$, C_6H_5); 7.49–7.56 (6H, м, C_6H_5); 7.63 (1H, с, H-6). Масс-спектр (ЭУ, 70 эВ, для изотопа ^{79}Br), m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 402 [$\text{M}]^+$ (100), 401 [$\text{M} - \text{H}]^+$ (21), 323 [$\text{M} - \text{Br}]^+$ (18), 165 (51), 89 (83), 77 [C_6H_5] $^+$ (30). Найдено, %: C 65.72; H 3.66; N 6.78. $\text{C}_{22}\text{H}_{15}\text{BrN}_2\text{O}$. Вычислено, %: C 65.51; H 3.72; N 6.95.

12-Метил-2-нитро-12Н-бензимидазо[2,1-*b*][1,3]бензоксазин (2) получают аналогично соединению **1** из 2-хлорбензимидазола и 2-(1-гидроксиэтил)-4-нитрофенола в виде светло-желтых кристаллов с т. пл. 191–192 °С (EtOH), выход 85%. ИК спектр (KBr), ν , cm^{-1} : 3047 (CH аром.), 2928, 2858 (CH_3), 1624, 1589 (C=C / C=N), 1524 (NO_2), 1493, 1481, 1443, 1350 (NO_2), 1273 (C–O–C), 1223, 744 (CH аром.). Спектр ЯМР ^1H (ДМСО- d_6 , 400 МГц), δ , м. д. (J , Гц): 1.77 (3H, д, $J = 7.9$, CH_3); 6.01 (1H, к, $J = 7.5$, H-12); 7.25–7.56 (5H, м, H-7,8,9,10); 8.25 (1H, д, $J = 8.1$, H-3); 8.48 (1H, с, H-1). Масс-спектр (ЭУ, 70 эВ), m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 281 [$\text{M}]^+$ (83), 266 [$\text{M} - \text{Me}]^+$ (100), 220 [$\text{M} - \text{Me} - \text{NO}_2$] $^+$ (80), 131 (38), 84 (39), 82 (57). Найдено, %: C 64.26; H 6.01; N 24.36. $\text{C}_{15}\text{H}_{11}\text{N}_3\text{O}_3$. Вычислено, %: C 64.06; H 6.11; N 23.33.

1. H. Singh, S. Sharma, R. N. Iyer, *Synthesis*, 325 (1975).
2. Л. К. Лабанадекас, А. Б. Брукштус, П. Г. Гайдялис, В. А. Бучинскайте, Э. Б. Удренайте, В. К. Даукшас, *Хим.-фарм. журн.*, **34**, № 7, 16 (2000).
3. E. S. Charles, K. V. B. Rao, S. Sharma, R. N. Iyer, *Arch. Pharm.*, **315**, 97 (1982).
4. R. P. Srivastava, S. Sharma, *Pharmazie*, **45**, 34 (1990).

Н. Е. Сидорина, В. А. Осянин

Поступило в редакцию 01.06.2005

**Самарский государственный
университет,
Самара 443011, Россия**
e-mail: sidorinan@inbox.ru

ХГС. – 2005. – № 9. – С. 1406
