

УДК 547.28 + 547.562 + 547.78+ 547.79

СИНТЕЗ О-АЛКИЛИРОВАННЫХ 4-[(1*H*-АЗОЛ-1-ИЛ)МЕТИЛ]ФЕНОЛОВ НА ОСНОВЕ (АДАМАНТИЛ-1)БРОММЕТИЛКЕТОНА

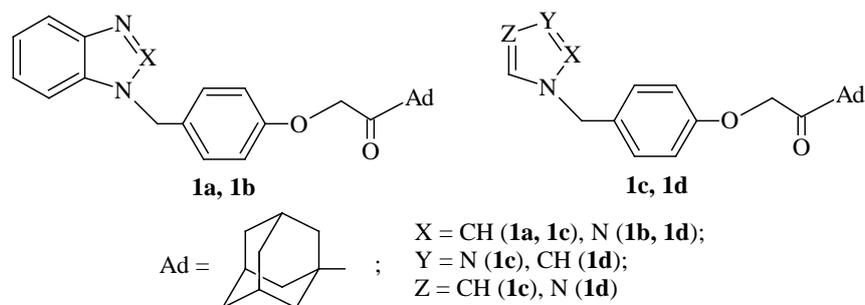
© Басанцев А.В., Данилин А.А., Пурыгин П.П.

Самарский национальный исследовательский университет
имени академика С.П. Королева, г. Самара, Российская Федерация

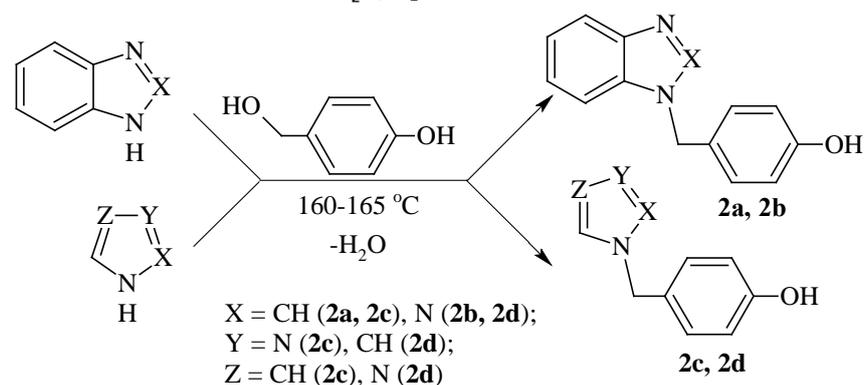
e-mail: arsenal902009@rambler.ru

Алкилирование свободной гидроксильной группы фенола и его С-производных служит основным методом синтеза простых эфиров [1]. Данная реакция в ряде случаев является одной из ключевых стадий при получении ряда лекарственных препаратов, например Фенацетина® и Тилорама® [2; 3].

Цель настоящего исследования – синтез 1-(адамантил-1)-2-(4-[(1*H*-азол-1-ил)метил]фенокси)этанонов-1 **1a-d** на основе О-алкилирования 4-[(1*H*-азол-1-ил)метил]фенолов **2a-d** (адамантил-1)бромметилкетоном.



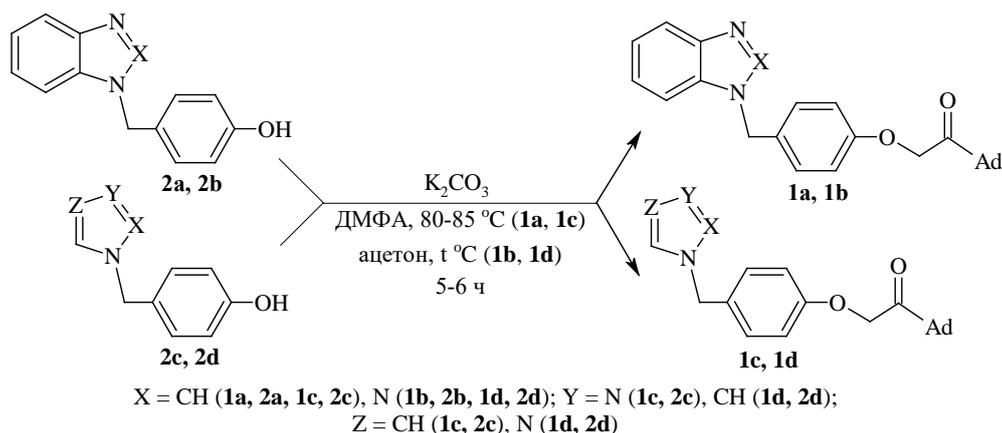
На первой стадии был осуществлен синтез 4-[(1*H*-азол-1-ил)метил]фенолов согласно представленным методикам [4; 5].



В качестве азолов были использованы бензимидазол, бензотриазол, имидазол и 1,2,4-триазол. В ходе данных реакций были получены соединения **2a-d** с выходами 46–91 % соответственно.

На следующей стадии было проведено О-алкилирование ранее полученных 4-[(1*H*-азол-1-ил)метил]фенолов с образованием 1-(адамантил-1)-2-(4-[(1*H*-азол-1-ил)метил]фенокси)этанонов-1 **1a-d** с выходами 44–79 %.

Реакции проводились в среде апротонных полярных растворителей (ДМФА, ацетон) при нагревании в присутствии карбоната калия в течение 5–6 ч.



Виртуальный компьютерный скрининг с использованием программы PASS Online показал возможное проявление антигипертензивной, противогрибковой, противовирусной и антидиабетической активности соединений **1a-1d**. Индивидуальность веществ была установлена при помощи ТСХ, их структура подтверждена данными элементного анализа, ЯМР ^1H и ИК-спектроскопии.

Библиографический список

1. Тимофеева С.А., Злотский С.С., Грудников И.Б., Юмакаева Ю.М. // Башкирский химический журнал. 2010. Т. 17, № 3. С. 25–29.
2. Morrison R.T., Boyd R.N. Organic Chemistry. 6th ed. Prentice Hall: Englewood Cliffs, NJ, 1992. 1360 p.
3. Zhang J., Yao Q., Liu Z. // Molecules. 2015. V. 20. I. 12. P. 21458–21463.
4. Osyanin V.A., Selezneva E.S., Belousova Z.P., Zarina L.F., Krel' N.E., Purygin P.P. // Khim-Farm. Zh. 2003. V. 37, № 9. P. 30–31.
5. Osyanin V.A., Sidorina N.E., Klimochkin Y.N. // Synthetic Communications. 2012. V. 42. P. 2639–2647.