

3. *Varlamov A. V., Sidorenko N. V., Zubkov F. I.* // Chem. Heterocycl. Compd. 2002. Vol. 38. P. 490–491.
4. *Zubkov F. I., Boltukhina E. V., Turchin K. F. et al.* // Tetrahedron. 2005. Vol. 61. P. 4099–4113.

*\* Работа выполнена при поддержке гранта РФФ 021417-2-007.*

УДК 547.814

**М. А. Артемьева<sup>1,2</sup>, К. В. Щербаков<sup>1</sup>,  
Я. В. Бургарт<sup>1,2</sup>, В. И. Салоутин<sup>1,2</sup>**

*<sup>1</sup>Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН,  
620137, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22,  
kvshcherbakov@gmail.com,*

*<sup>2</sup>Уральский федеральный университет  
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,  
620078, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19*

## **РАЗРАБОТКА ПОДХОДА К СИНТЕЗУ НЕЗАМЕЩЁННЫХ ПОЛИФТОРФЛАВОНОВ**

**Ключевые слова:** полифторфлавоны, перегруппировка Бейкера-Венкатарамана.

Хромен-4-оновый остов входит в состав многих лекарственных препаратов как синтетического, так и природного происхождения. В их ряду наиболее перспективными для дизайна биоактивных молекул являются флавоны.

Одним из основных подходов к формированию пиринового цикла флавонов является циклизация замещённых *o*-гидроксиацетофенонов с хлорангидами бензойных кислот с последующей перегруппировкой промежуточных *o*-ароилоксиацетофенонов по Бейкеру-Венкатараману. Однако классические условия, применяемые для синтеза нефторированных флавонов, оказались неэффективными для получения 2-полифторфенил-содержащих аналогов. При действии таких оснований, как NaOH, KOH, NaN, в различных сольвентах не удалось достигнуть существенной конверсии *o*-ароилоксиацетофенонов **2a-e**, а в случае тетрафтор- и пентафтор-бензоилоксиацетофенонов процесс завершался осмолением реакционной массы. Однако при реализации перегруппировки в присутствии DBU в пиридине

удалось существенно повысить выход фторсодержащих диароилметанов **3a-d**, которые в кислой среде почти количественно циклизовались в целевые полифторфлавоны **4a-c** за счет внутримолекулярной конденсации гидроксигруппы с карбонильной группой полифторбензоильного фрагмента.

Следует отметить, что превращения пентафторбензоилсодержащих производных отличаются от реакций аналогов с меньшим содержанием атомов фтора. Так, перегруппировку пентафторбензоилоксиацетофенона **3d** удалось реализовать только в метаноле под действием  $\text{CaH}_2$ , при этом в качестве побочного продукта образовывался 1,3-дикетон **5**. Кроме того, кислотно-катализируемая циклизация пентафторфенилзамещенного 1,3-дикетона **3d** протекает по альтернативному маршруту за счет элиминирования фтороводорода с образованием 2-(2-гидроксифенил)-5,6,7,8-тетрафторфлавона, о чем свидетельствует выделение двух продуктов его *O*- и *C*-ацилирования **6**, **7**. Образование же 2-(пентафторфенил)флавона **4d** в смеси зафиксировано только методом ЯМР  $^{19}\text{F}$  спектроскопии.

