



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **385**

(51) ) **МПК(2006) С 07 D**  
**265/00; 273/00**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ  
ВЕДОМСТВО

# (12) **Описание изобретения** К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

(21) 1000463

(22) 07.05.2010

(46) Бюл.60 (4), 2010

(71) Бандаев С.Г. (ТJ); Гулов Т.Ё. (ТJ).

(72) Бандаев С.Г. (ТJ); Гулов Т.Ё. (ТJ).

(73) Бандаев С.Г. (ТJ); Гулов Т.Ё. (ТJ).

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ **ТРАНС-1,2-БИС-(БЕНЗ[С]ИЗОКСАЗОЛИЛ-3) ЦИКЛО-БУТАНОВ**

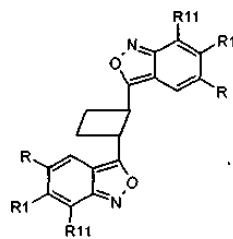
(56) 1. Pryor W.A., Iino M, Ntwkome G.R. 1,4-Diradicals and the isotope effect on the spontaneous polymerization of penta fluorostyrene//J.Amer. Chem.Soc., 1977, Vol. 99, №18, P. 6003.

2. Coyner E.G., Hillman W.S. The thermal dimerization of acrylonitrile//J.Amer. Chem.Soc., 1949, Vol. 71, №1, P. 324.

3. Nishimura J., Horikoshi V. Intermolecular 2+2-photocycloaddition//Tetrahedron Lett., 1989, Vol. 30, №40, P. 5439.

4. Бандаев С.Г. и др. Аддукты сольвомеркурирования 2-нитрофенилциклопропанов в синтезе 1,2-бисгетероциклициклобутанов. Известия ТО МАН ВШ, 2009, №2, стр. 64.

(57) Изобретение относится к области химии гетероциклических соединений, а именно к усовершенствованному способу получения новых транс-бис(бенз[с]-изоксазолил-3)-цикло-бутанов общей формулы I

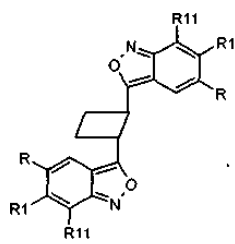


**I**

где R=H, Cl; R<sup>1</sup> = H, Br; R<sup>11</sup> = H, Cl.

Изобретение относится к области химии гетероциклических соединений, а именно к усовершенствованному способу

получения новых **транс-бис(бенз[с]-изоксазолил-3)-цикло-бутанов** общей формулы I



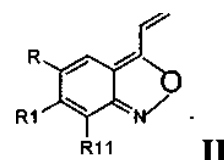
где R=H, Cl; R<sup>1</sup>=H, Br; R<sup>11</sup>=H, Cl.

Найдена высокая активность винильного фрагмента 3-винил-бенз[с]изоксазолов в реакции [2+2]-циклоприсоединения, их протекания с высокой степенью хемо-, регио- и стереоселективности, открывают широкие перспективы использования указанных бензизоксазолов в органическом синтезе.

Имеющиеся данные по реакциям [2+2]-циклоприсоединения монозамещенных этиленов, свидетельствуют о том, что для их протекания необходимы довольно жесткие условия, например, нагревание исходного субстрата до температуры порядка 150-200 °С [1], при повышенном давлении [2], либо облучением УФ-светом [3]. Большинство из этих реакций посвящены «перекрестному» типу превращения или социклизации. Что касается реакции [2+2]-циклоприсоединения алкенов, протекающих по типу «сам на себя», то они изучены значительно меньше, при этом крайне мало работ посвящены превращениям монозамещенных этиленов.

Целью изобретения является расширение ассортимента, ранее неизвестных целевых продуктов реакции I. Поставленная цель достигается тем, что 3-винилбенз[с]изоксазолы общей

формулы II



где R, R<sup>1</sup>, R<sup>11</sup> имеют приведённые значения, очень легко вступают в реакцию [2+2]-циклоприсоединения. Процесс идёт на рассеянном свете, при 20 °С, без растворителя и превращения исходного соединения II осуществляется хемо-, регио- и стереоселективно.

Получение транс-1,2-бис(бенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутана иллюстрируется следующим примером:

**Пример 1** 2,9 г (20 ммоль) 3-винилбенз[с]изоксазола помещали в круглодонную колбу, которую дегазировали под вакуумом. Затем колбу заполняли азотом и закрыв пробкой, оставляли на дневном свете в течении 100 часов. Реакционную массу хроматографировали на колонке с Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>, с получением 0,52 г (18%) исходного соединения (элюент- CCl<sub>4</sub>). Затем, заменив CCl<sub>4</sub> на смесь CCl<sub>4</sub>:CHCl<sub>3</sub> (1:1), выделяют 2,0 г (70%) транс-1,2-бис(бенз[с]изоксазол-3-ил)циклобутана (I), которую перекристаллизовывают из смеси эфира и петролейного эфира (1:5), т.пл. 100-101 °С. (лит.дан. 100°С[4]).

В таблице приведены результаты получения по аналогии других гетероциклициклобутанов общей формулы I.

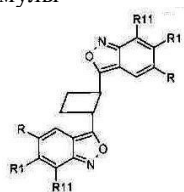
Таким образом, предлагаемый способ позволяет легко получить новый, ранее неизвестный класс соединений - транс-1,2-бис(бенз[с]изоксазол-3-ил)циклобутан (гетероциклициклобутан)-ов, а также существенно расширить их ассортимент путём синтеза новых. Кроме того, предлагаемый способ позволяет использовать в качестве исходных веществ более широкий ассортимент 3-винилбенз[с]изоксазолов.

транс-Бис(бенз[с]-изоксазол-3-ил)-циклобутаны общей формулы I, полученные по предлагаемому способу

| Название циклобутана                                         | R  | R <sup>1</sup> | R <sup>11</sup> | Выход, % | Т.пл °С |
|--------------------------------------------------------------|----|----------------|-----------------|----------|---------|
| транс-1,2-бис(бенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан              | H  | H              | H               | 70       | 100     |
| транс-1,2-бис(6-бромбенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан        | H  | Br             | H               | 67       | 164     |
| транс-1,2-бис(5-хлорбенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан        | Cl | H              | H               | 33       | 87      |
| транс-1,2-бис(7-хлорбенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан        | H  | H              | Cl              | 35       | 73      |
| транс-1,2-бис(5-хлор-6-бромбенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан | Cl | Br             | H               | 37       | 194     |
| транс-1,2-бис(6-бром-7-хлорбенз[с]изоксазол-3-ил)-циклобутан | H  | Br             | Cl              | 42       | 134     |

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. *транс*-1,2-бис-(бенз[с]изоксазолил-3) циклобутан общей формулы



где R = H или Cl; R<sup>1</sup> = H или Br; R<sup>11</sup> = H или Cl.

2. Способ получения *транс*-1,2-бис-(бенз[с]изоксазолил-3) циклобутанов, заключающийся в том, что путем фотохимической реакции 3-винилбенз[с]изоксазола подвергают реакции [2+2]-циклоприсоединения, а в качестве источника света используют рассеянный свет, при 20°C, без растворителя. |

Компьютерный набор: Назарова Дж.Д.

Заказ

Тираж

Подписное

Национальный патентно-информационный центр РТ  
734042, г. Душанбе, ул. Айни, 14а.