

COMPARISON BETWEEN CONVENTIONAL AND NONCONVENTIONAL METHODS FOR THE SYNTHESIS OF SOME OXAZOLIDIN-2-ONE DERIVATIVES AND PRELIMINARY INVESTIGATION OF THEIR INHIBITOR ACTIVITY AGAINST CERTAIN PROTEIN KINASES¹

S. Ziane^{a,*}, M. M. Mazari^a, A. M. Safer^a, A. Sad El Hachemi Amar^a, S. Ruchaud^b,
B. Baratte^b, and S. Bach^b

^a *Université Oran 1 Ahmed Ben Bella, Laboratoire de Synthèse Organique Appliquée (LSOA), Département de Chimie, Faculté des sciences exactes et appliquées, BP 1524 EL Mnaouer, 31000 Oran, Algeria*

**e-mail: saidaz37@yahoo.com*

^b *Station biologique de Roscoff, USR 3151, CNRS-UPMC, KISSf platform, place Georges Teissier, Bp 74, 29682 Roscoff, France*

Received January 27, 2019; revised March 23, 2019; accepted May 16, 2019

Ряд пропаргил- и аллил-карбаматов получен реакцией пропаргилловых и аллиловых спиртов непосредственно с изоцианатами, а также путем генерирования изоцианатов *in situ* из соответствующих Cbz-защищенных аминов. Полученные пропаргил-фенилкарбаматы подвергались внутримолекулярной нуклеофильной циклизации в присутствии CsOH·H₂O в качестве основания в диметилформамиде при комнатной температуре и в условиях ультразвуковой активации с образованием замещенных 4-метилен(бензилиден)-3-фенил-1,3-оксазолидин-2-онов с выходами 87–99%. Использование ультразвукового облучения позволяет увеличить выход продуктов циклизации и существенно сократить время реакции (с 20–120 мин до 10 с–26 мин). В некоторых случаях циклизация протекала с высокой стереоселективностью с образованием (4*Z*)-4-бензилиден-3-фенил-1,3-оксазолидин-2-онов в качестве единственного стереоизомера. Изучена ингибирующая активность синтезированных соединений по отношению к некоторым протеинкиназам.

Keywords: пропаргил-карбаматы, аллил-карбаматы, изоцианаты, внутримолекулярная циклизация, 3-фенил-1,3-оксазолидин-2-оны, ультразвуковая активация, ингибирование протеинкиназ.

DOI: 10.1134/S0514749219070243

¹ Полный текст статьи печатается в английской версии журнала.