УДК 547.78 + 67

СИНТЕЗ И ПРЕВРАЩЕНИЕ 3-ФЕНИЛ-1*H*-[1,4]ОКСАЗИНО[4,3-*a*]БЕНЗИМИДАЗОЛ-1-ОНА В 4-ФЕНИЛ-2,5-ДИГИДРО-1*H*-[1,2,5]ТРИАЗЕПИНО-[5,4-*a*]БЕНЗИМИДАЗОЛ-1-ОН

© 2021 г. А. О. Харанеко*, Т. М. Пехтерева, О. И. Харанеко

ГУ «Институт физико-органической химии и углехимии им. Л.М. Литвиненко»,
Украина, 83114 Донецк, ул. Р. Люксембург, 70
**e-mail: antonhar08@rambler.ru*

Поступила в редакцию 13.12.2020 г.
После доработки 25.12.2020 г.
Принята к публикации 26.12.2020 г.

Предложен метод синтеза 3-фенил-1*H*-[1,4]оксазино[4,3-*a*]бензимидазол-1-она -первого представителя новой гетероциклической системы бензимидазоло-α-пиронов и изучено его превращение в 4-фенил-2,5-дигидро-1*H*-[1,2,5]триазепино[5,4-*a*]бензимидазол-1-он в реакции с гидразингидратом.

Ключевые слова: метил 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилат, 3-фенил-1*H*-[1,4]оксазино[4,3-*a*]бензимидазол-1-он, 2-(1*H*-бензимидазол-1-ил)-1-фенилэтанон, 4-фенил-2,5-дигидро-1*H*-[1,2,5]-триазепино[5,4-*a*]бензимидазол-1-он, 3-фенилпиразино[1,2-*a*]бензимидазол-1(2*H*)-он

DOI: 10.31857/S0514749221030113

ВВЕДЕНИЕ

Интерес к гетероконденсированнным 1,2,5-триазепинам связан с широким спектром их биологической активности [1]. Однако создание лекарственных препаратов на их основе сдерживается малой доступностью таких соединений. В природе они не встречаются, единственный источник такого рода структур – органический синтез. К сожалению, в литературе отсутствуют систематические исследования методов сборки и аннелирования 1,2,5-триазепинового цикла.

Ранее нами была предложена стратегия синтеза первого представителя новой гетероциклической системы 1,4-дифенил-5*H*-[1,2,5]триазепино[5,4-*a*]бензимидазола [2], основанная на реакции 2-(2-бензоил-1*H*-бензимидазол-1-ил)-1-фенилэтанона с гидразингидратом и последующей термической гетероциклизации образовавшегося продукта. Принимая во внимание, что аннелирование 1,2,5-триазепинового цикла к другому гетероциклическому ядру по аналогии с аннелированием 1,2-диазепинового цикла может быть осуществлено не только в реакции 1,5-дикарбонильных соединений с гетероциклом в цепи с гидразином [3], но и в реакции гетероконденсированных α-пиронов с гидразином [1], и продолжая наши исследования по синтезу бензимидазоло[1,2,5]триазепинов, мы попытались осуществить и такой протокол реакции.

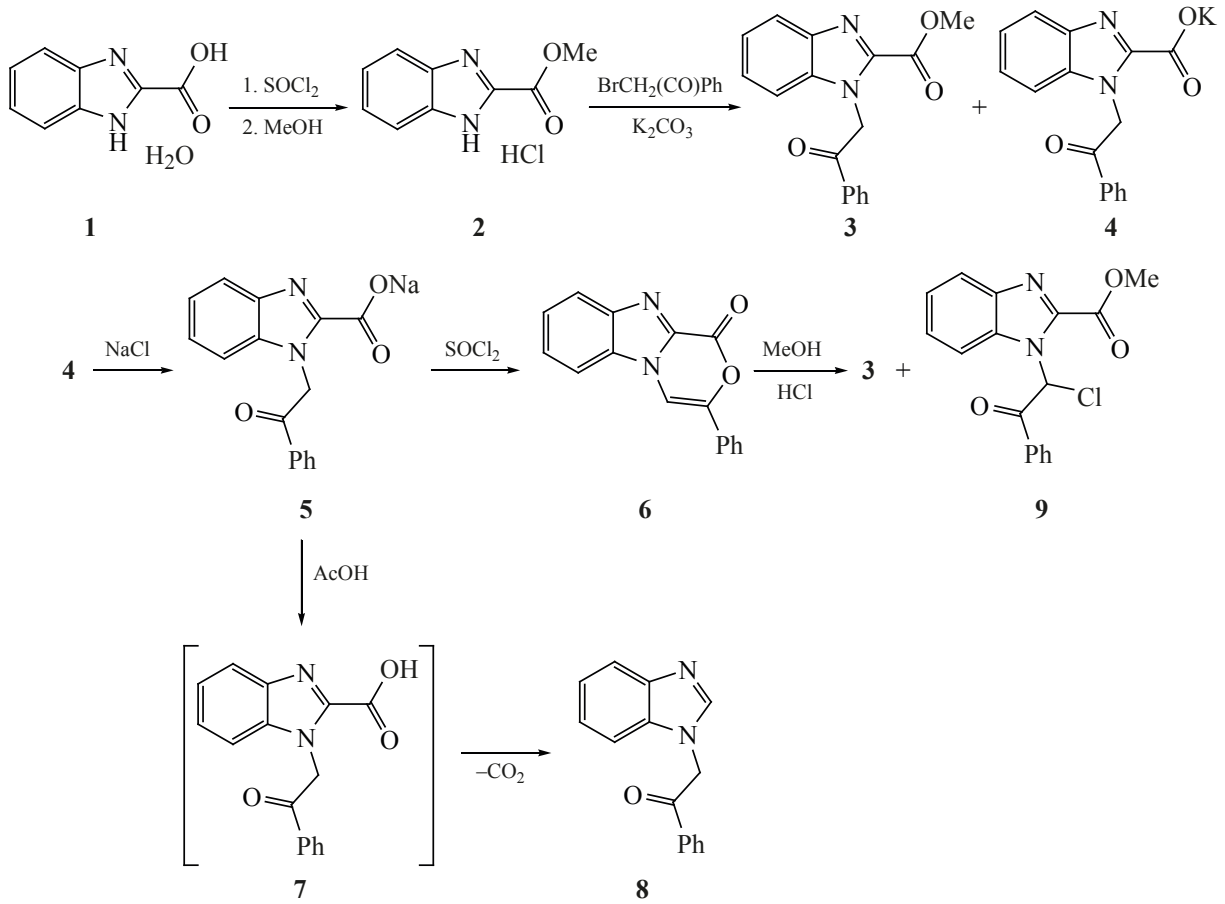
Цель работы стал поиск препаративного метода синтеза бензимидазоло-α-пирона и его превращение в соответсвующий бензимидазоло[1,2,5]триазепин.

РЕЗУЛЬТАТЫ И ОБСУЖДЕНИЕ

Стратегия синтеза 3-фенил-1*H*-[1,4]оксазино[4,3-*a*]бензимидазол-1-она **6** представлена на схеме 1.

Метиловый эфир **2** был получен по методу, аналогичному предложенному в [4]. Калий 1-(2-ок-

Схема 1

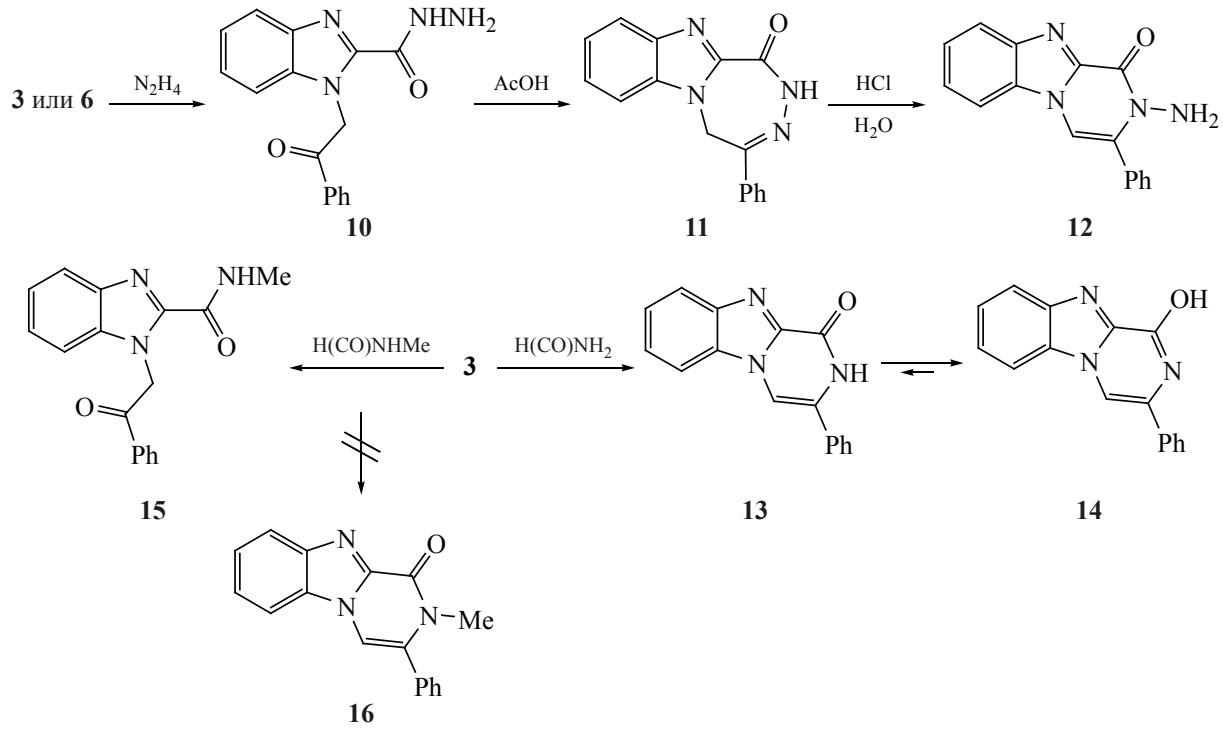


со-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилат **4** – продукт фенацилирования метилового эфира **2**. Эта реакция может быть проведена в ацетоне или ацетонитриле, но лучший результат был получен в неабсолютизированном ацетонитриле. В результате такой реакции образуется смесь метил 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилата **3** и калий 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилата **4**, который из-за низкой растворимости выводился из системы. Далее в работе использовали натриевую соль бензимидазола **5**, полученную из калиевой соли **4**, из-за ее плохой растворимости в воде.

Циклизацию натрий 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилата **5** проводили в среде тионилхлорида как растворителя и реагента с последующей полной отгонкой тионилхлорида. Целевой продукт 3-фенил-1*H*-[1,4]оксазино[4,3-*a*]-бензимидазол-1-он **6** практически нерастворим в метаноле. Это позволило выделить его с выходом 50% из реакционной массы в виде мелкого бледно-желтого порошка, добавив к ней абсолютный метанол. В метанольном маточнике было обнаружено небольшое количество метил 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилата **3** и метил 1-(1-хлор-2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилата **9**. Кетоэфир **3**, по-видимому, образуется в результате переэтерификации оксазинона **6** катализируемой следами HCl, возникающей из остатков тионилхлорида с метанолом. Присутствие соединения **9** нам объяснить не удалось. Возможно, такое хлорирование протекает по радикальному механизму под воздействием света.

Кипячение кетоэфира **3** в уксусном ангидриде в течение 8 ч также дает оксазинон **6** с выходом около 10% в виде желтоватых игольчатых кристаллов. ЯМР-спектры этого продукта и продукта, выделенного в реакции бензимидазола **5** с тионилхлоридом, полностью идентичны. Увеличение

Схема 2



продолжительности кипячения эфира **3** приводит лишь к осмолению реакционной массы.

Полученный оксазин **6** стал первым представителем новой гетероциклической системы бензимидазоло-α-пиронов.

При подкислении водного раствора натриевой соли **5** выделяется кислота **7**, высушенная при комнатной температуре в течение суток. Оказалось, что за это время кислота полностью декарбоксилировалась до 2-(1*H*-бензимидазол-1-ил)-1-фенилэтанона **8**.

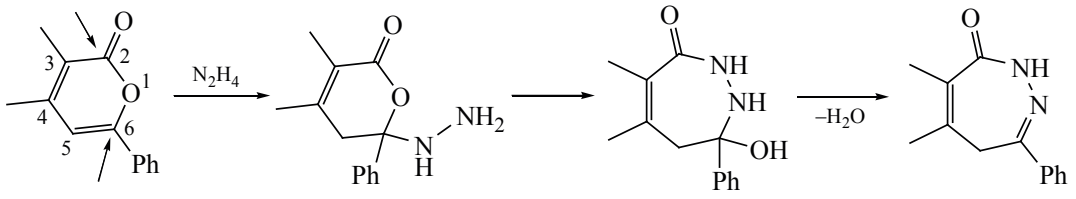
По аналогии с данными [5, 6, 7] можно было предположить, что оксазинон **6** в реакции с гидразингидратом даст 4-фенил-2,5-дигидро-1*H*-[1,2,5]-триазепино[5,4-*a*]бензимидазол-1-он **11**. Однако этого не произошло. Был выделен 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксигидразид **10**. Гидразон по фенацильной группе в этих условиях не обнаружен. Такой же результат дает и кетоэфир **3** (схема 2). Полученный гидразид **10** в уксусной кислоте с хорошим выходом циклизуется в триазепинон **11**. Такая циклизация соответствует механизму представленному ранеев [8].

Известна способность триазепинового цикла к сужению под действием минеральных кислот [9]. В случае с триазепиноном **11** такого сужения не происходит. При действии кипящей соляной кислоты в течение 5 мин происходит гидролиз триазепинона **11** и его декарбоксилирование до бензимидазола **8**.

Отметим, что кетоэфир **3** может вступать в реакцию не только с гидразином, но и с другими *N*-нуклеофилами. При кипячении кетоэфира **3** с избытком формамида в течение 30 мин с количественным выходом образуется 3-фенилпиразино[1,2-*a*]-бензимидазол-1-ол **14**. Его резонансная структура 3-фенилпиразино[1,2-*a*]бензимидазол-1(2*H*)-он **13**. Кипячение кетоэфира **3** в *N*-метилформамиде в течение 30 мин дает *N*-метил-1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксамид **15**. Ароматизациия пиразинона **13** в 3-фенилпиразино[1,2-*a*]бензимидазол-1-ол **14** объясняет его количественное образование, что невозможно в случае с *N*-метилформамидом и 2-метил-3-фенилпиразино[1,2-*a*]бензимидазол-1(2*H*)-он **16** не образуется.

Ранее на примере пиразолооксозепина [5] и изокумарина [6] было показано, что рециклизация

Схема 3



17 **18**

6-фенил-2*H*-пиран-2-она **17** сгидразином до диазепинона **18** начинается с атаки гидразина по C^6, т.к. двойная связь C^5–C^6 поляризована и положительный заряд расположен у C^6 (схема 3). Такой механизм [7, 8, 9] характерен для лактонов с π-амфотерными или π-избыточными ароматическими циклами.

Но в структуре **17** имеется еще один реакционный центр C^2. Однако, в силу сопряжения карбонильной группы с расположенным рядом ароматическим ядром, реакционный центр C^2 слабо выражен.

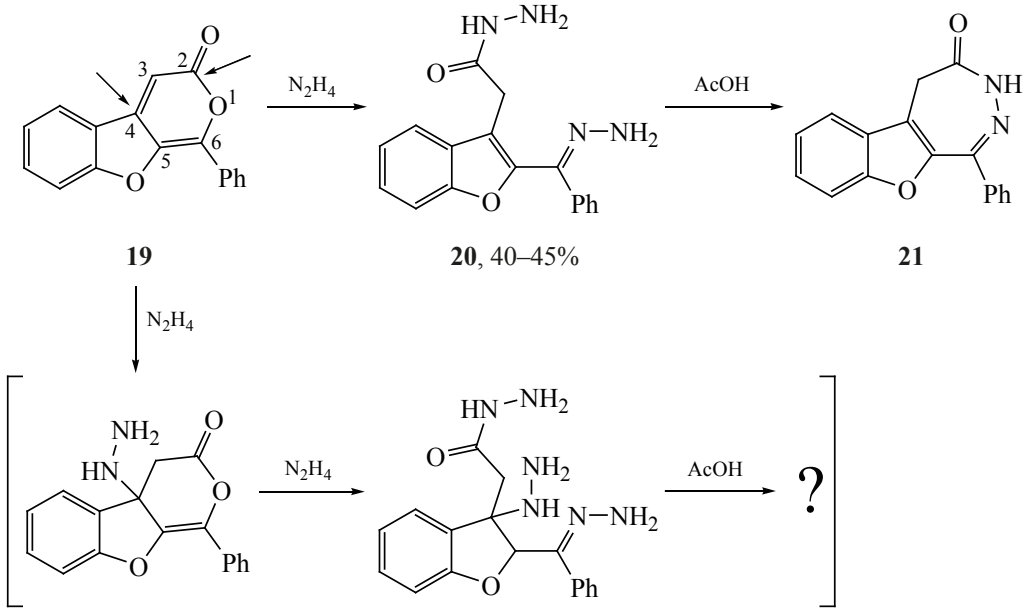
Оксазинон **6** имеет имидазольную π-дифицитную ароматическую систему и в данном случае связь C^5–C^6 не поляризована. Поэтому реакционным центром становится C^2, что объясняет образование гидразида **10**. Дальнейшая циклизация гидразида **10** в триазепинон **11** протекает по механизму, предложенному в [10].

Одним из примеров раскрытия гидразином лактонового цикла, у которого связь C^5–C^6 не поляризована, описан С.В. Толкуновым и сотрудниками [11]. Полученный ими 1-фенил-3*H*-пирано[3,4-*b*][1]бензофуран-3-он **19** дает с гидразином 2-{2-[(*E,Z*)-гидразоно(фенил)метил]-1-бензофуран-3-ил}ацетогидразид **20**, а не соответствующий диазепинон **21** (схема 4).

У C^5 и C^6 расположены одинаковые заместители и двойная связь C^5–C^6 не поляризована. Поэтому наиболее вероятным реакционным центром будет C^2, что и наблюдалось авторами [11].

У данного соединения есть еще один реакционный центр C^4, т.к. представленное соединение можно рассматривать как 2-фенилакриловый

Схема 4



19 **20**, 40–45% **21**

22 **23**

эфир, а для него характерно присоединение гидразина по реакции Михаэля с образованием 4*a*-гидразино-1-фенил-4,4*a*-дигидро-3*H*-пирано[3,4-*b*]-[1]бензофуран-3-она **22**, который в последствии, с имеющимся избытком гидразина, может дать 2-{3-гидразино-2-[(*E,Z*)-гидразоно(фенил)метил]-2,3-дигидро-1-бензофуран-3-ил}ацетогидразид **23**. Вероятно, продукт **23** остался в маточнике после перекристаллизации продуктов реакции взаимодействия лактона **19** с гидразином. Особый интерес представляет циклизация гидразидгидразона **23** в тех же условиях, что и гидразидгидразона **20**.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР ^{1}H и ^{13}C записаны на приборе Bruker Avance II (400 и 100 МГц, соответственно) в ДМСО-d_6, внутренний стандарт ТМС. Температуры плавления синтезированных соединений определены на нагревательном приборе типа Boetius и не подвергались коррекции.

Метил 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилат (3). Смесь 10 г (47 ммоль) соединения **2**, 14 г (70 ммоль) γ-бромацетофенона и 16 г (0.116 моль) мелкоизмельченного K_2CO_3 перемешивали в 140 мл ацетонитрила при кипении в течение 6 ч. Смесь охладили, отфильтровали и промыли ацетонитрилом осадок. Ацетонитрил полностью удалили отгонкой, и остаток перекристализовали из пропанола-2. Выход 2.6 г (19%), бесцветные кристаллы, т.пл. 165–166°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 3.88 с (3H, CH_3), 6.23 с (2H, CH_2), 7.34 т (1H, CH, *J* 6.8 Гц), 7.39 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.60 т (2H, CH, *J* 7.6 Гц), 7.65–7.75 м (2H, CH), 7.81 д (1H, CH, *J* 7.6 Гц), 8.12 д (2H, CH, *J* 7.6 Гц). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 51.6 (CH_2), 52.1 (CH_3), 111.1 (CH), 120.9 (CH), 123.0 (CH), 124.9 (CH), 128.0 (2CH), 128.5 (2CH), 133.6 (CH), 134.4, 136.4, 140.6, 141.2, 159.9, 192.3 (CO). Найдено, %: C 69.34; H 4.83; N 9.57. $C_{17}H_{14}N_2O_3$. Вычислено, %: C 69.38; H 4.79; N 9.52; O 16.31.*M* 294.31.

Натрий 1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилат (5). Отфильтрованный осадок перемешивали в 200 мл насыщенного раствора NaCl при 80°C 30 мин. Смесь охладили, отфильтровали **5** и промыли насыщенным раствором NaCl и высушили.

2-(1*H*-Бензимидазол-1-ил)-1-фенилэтанон (8). К раствору 0.5 г соединения **5** в 5 мл воды добавили уксусную кислоту до pH 6, отфильтровали выпавший осадок и промыли водой. Выход 260 мг (95%), бесцветные кристаллы, т.пл. 120–121°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 5.96 с (2H, CH_2), 7.15–7.24 м (2H, CH), 7.35–7.44 м (1H, CH), 7.59 т (2H, CH, *J* 7.6 Гц), 7.36–7.66 м (1H, CH), 7.70 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 8.08 с (1H, CH), 8.11 д (2H, CH, *J* 7.6 Гц). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 50.5 (CH_2), 110.1 (CH), 119.2 (CH), 121.0 (CH), 121.9 (CH), 128.0 (2CH), 128.5 (2CH), 133.5 (CH), 134.4, 143.1, 144.5 (CH), 192.6 (CO). Найдено, %: C 76.21; H 5.18; N 11.89. $C_{15}H_{12}N_2O$. Вычислено, %: C 76.25; H 5.12; N 11.86; O 6.77.*M* 236.28.

3-Фенил-1*H*-[1,4]оксазино[4,3-*a*]бензимидазол-1-он (6). К 100 мл $SOCl_2$ при перемешивании добавили 5–6 капель ДМФА и постепенно присыпали натриевую соль **5**. Перемешивали 15 мин при комнатной температуре и кипятили 1 ч. После охлаждения и отгонки $SOCl_2$ к остатку добавили при перемешивании абсолютный метанол. Перемешивали 10 мин и отфильтровали осадок. Осадок промыли абсолютным метанолом и водой. Выход 6.2 г (50%), мелкие желтые кристаллы, т.пл. 248–249°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 7.43 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.46–755 м (3H, CH), 7.67 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.88 д (2H, CH, *J* 8.0 Гц), 7.91 д (1H, CH, *J* 8.4 Гц), 8.21 д (1H, CH, *J* 8.4 Гц), 8.91 с (1H, CH). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 103.4 (CH), 112.6 (CH), 121.3 (CH), 124.0 (2CH), 125.3 (CH), 125.7 (CH), 128.7 (2CH), 129.1 (CH), 129.9, 130.4, 134.6, 141.2, 143.0, 152.5 (CO). Найдено, %: C 73.18; H 3.87; N 10.71. $C_{16}H_{10}N_2O_2$. Вычислено, %: C 73.27; H 3.84; N 10.68; O 12.20. *M* 262.27.

Метил 1-(1-хлор-2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксилат (9). После удаления метанола из маточника при получении **6**, остаток перекристаллизовали из пропанола-2. Полученный кристаллический продукт 1.35 г содержал имдазолы **3** и **9** в соотношении 2:3. После повторной кристаллизации из 8 мл метанола получено 0.5 г соединения **9**, бесцветные кубические кристаллы, т.пл. 140–141°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 4.02 с (3H, CH_3), 7.37 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.43 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.51 т (2H, CH, *J* 8.0 Гц), 7.60–7.67 м (2H, CH), 7.79 д (1H, CH, *J* 8.0 Гц), 7.98 д (2H, CH, *J* 8.0 Гц), 8.93 с (1H, CHCl). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 52.8 (CH_3), 66.0 (CHCl), 113.9 (CH),

121.4 (CH), 123.9 (CH), 125.7 (CH), 128.5 (2CH), 128.6 (2CH), 132.8, 133.7 (CH), 134.1, 139.9, 141.4, 159.8 (COO), 187.1 (CO). Найдено, %: C 62.07; H 4.04; Cl 10.77; N 8.56. $C_{17}H_{13}ClN_2O_3$. Вычислено, %: C 62.11; H 3.99; Cl 10.78; N 8.52; O 14.60. *M* 328.76.

1-(2-Оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксигидразид (10). Кипятили 0.8 ммоль **3** или **6** в 3 мл метанола с 2 ммоль гидразингидрата в течение 1 ч. Добавили 8 мл воды и выпавший осадок отфильтровали. Выход 130 мг (58%), бесцветные мелкие кристаллы, т.пл. 177–178°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 6.29 с (2H, CH_2), 7.25–7.35 м (2H, CH), 7.55–7.65 м (3H, CH), 7.69 т (1H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.73–7.79 м (1H, CH), 8.12 д (2H, CH, *J* 7.6 Гц), 10.09 уш.с (1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 51.2 (CH_2), 110.7 (CH), 119.9 (CH), 122.6 (CH), 123.7 (CH), 128.0 2CH), 128.5 (2CH), 133.4 (CH), 134.6, 136.4, 140.9, 142.9, 157.8 (CONH), 192.5 (CO). Найдено, %: C 65.37; H 4.83; N 19.07. $C_{16}H_{14}N_4O_2$. Вычислено, %: C 65.30; H 4.79; N 19.04; O 10.87. *M* 294.32.

4-Фенил-2,5-дигидро-1*H*-[1,2,5]триазепино-[5,4-*a*]бензимидазол-1-он (11). Кипятили 162 мг (0.6 ммоль) **10** в смеси 0.1 мл уксусной кислоты с 3 мл воды в течение 30 мин. После охлаждения осадок отфильтровали. Выход 150 мг (98%), бесцветные мелкие кристаллы, т.пл. 248–249°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 5.60 с (2H, CH_2), 7.30 т (1H, CH, *J* 6.4 Гц), 7.35–7.51 м (4H, CH), 7.74 д (1H, CH, *J* 7.6 Гц), 7.96–8.12 м (3H, CH), 11.70 с (1H, NH). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 39.8 (CH_2), 110.8 (CH), 120.6 (CH), 122.9 (CH), 124.5 (CH), 126.8 (2CH), 128.5 (2CH), 130.4 (CH), 132.9, 133.7, 142.0, 144.1, 157.0, 157.6. Найдено, %: C 79.59; H 4.42; N 20.31. $C_{16}H_{12}N_4O$. Вычислено, %: C 79.55; H 4.38; N 20.28; O 5.79. *M* 276.30.

3-Фенилпиразино[1,2-*a*]бензимидазол-1(2*H*)-он (13). Кипятили 30 мин 200 мг (0.7 ммоль) соединения **3** в 2 мл формамида. Смесь охладили, выпавшие бесцветные кристаллы отфильтровали и промыли водой, выход 165 мг (93%), т.пл. 342–343°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 7.39–7.54 м (5H, CH), 7.79 д (2H, CH, *J* 7.2 Гц), 7.86–7.92 м (1H, CH), 8.21 м (1H, CH), 8.34 с (1H, CH), 11.78 уш.с (1H, NH или OH). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 103.6 (CH), 112.6 (CH), 120.7 (CH), 124.0 (CH), 126.4 (2CH), 127.4, 128.6 (2CH), 128.8 (CH), 130.3, 131.4, 139.7, 142.8, 154.8 (CO). Найдено, %: C 73.63; H 4.29; N 16.12. $C_{16}H_{11}N_3O$. Вычислено, %: C 73.55; H 4.24; N 16.08; O 6.12. *M* 261.29.

***N*-Метил-1-(2-оксо-2-фенилэтил)-1*H*-бензимидазол-2-карбоксамид (15).** Кипятили 30 мин 200 мг (0.7 ммоль) **3** в 2 мл *N*-метилформамида. Смесь охладили и добавили 5 мл воды. Осадок отфильтровали, промыли водой и высушили. После перекристаллизации из метанола выход 73 мг (35%), бесцветные кристаллы, т.пл. 172–173°C. Спектр ЯМР ^{1}H, δ, м.д.: 2.79 д (3H, CH_3, *J* 4.6 Гц), 6.28 с (2H, CH_2), 7.25–7.35 м (2H, CH), 7.55–7.62 м (3H, CH), 7.69 т (1H, CH, *J* 7.6 Гц), 7.72–7.77 м (1H, CH), 8.11 д (2H, CH, *J* 7.6 Гц), 8.80 к (1H, NH, *J* 4.6 Гц). Спектр ЯМР ^{13}C, δ, м.д.: 25.5 (CH_3), 51.3 (CH_2), 110.8 (CH), 119.8 (CH), 122.6 (CH), 123.7 (CH), 128.0 (2CH), 128.4 (2CH), 129.5, 133.3 (CH), 134.6, 136.6, 140.7, 159.4 (CON), 192.4 (CO). Найдено, %: C 69.65; H 5.19; N 14.38. $C_{17}H_{15}N_3O_2$. Вычислено, %: C 69.61; H 5.15; N 14.33; O 10.91. *M* 293.33.

ВЫВОДЫ

Нами предложен препаративный метод синтеза бензимидазоло-α-пирона и изучено его превращение в соответсвующий бензимидазоло[1,2,5]-триазепин. Рассмотрен возможный механизм соответствующего превращения. Показано, что для синтеза триазепинона **11** или других циклических производных на основе бензимидазол-2-карбоновой кислоты необязательно получать лактон **6**, достаточно получить кетоэфир **3**.

КОНФЛИКТ ИНТЕРЕСОВ

Авторы заявляют об отсутствии конфликта интересов.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Elattar K.M., Abozeid M.A., Etman H.A. *Synth. Commun*. **2016**, *46*, 93–117. doi 10.1080/00397911.2015.1109126
2. Харанеко А.О. *ЖОрХ*. **2019**, *55*, 123–126. [Kharaneko A.O. *Russ. J. Org. Chem*. **2019**, *55*, 115–117.] doi 10.1134/S0514749219010117
3. Харанеко А.О. *ЖОрХ*. **2016**, *52*, 904–908. [Kharaneko A.O. *Russ. J. Org. Chem*. **2016**, *52*, 892–896.] doi 10.1134/S1070428016060221

4. Copeland R.A.B., Day A.R. *J. Am. Chem. Soc*. **1943**, *65*, 1072–1075. doi 10.1021/ja01246a019

5. Харанеко А.О., Харанеко О.И. *ЖОрХ*. **2018**, *54*, 738–742. [Kharaneko A.O., Kharaneko, O.I. *Russ. J. Org. Chem*. **2018**, *54*, 742–746.] doi 10.1134/S1070428018050111

6. Шабликіна О.В., Крехова О.Ф., Коноваленко А.С., Москвіна В.С., Хиля В.П. *Допов. Нац. акад. наук Укр*. **2018**, *12*, 71–78. doi 10.15407/dopovidi2018.12.071

7. Харанеко А.О., Пехтерева Т.М., Харанеко О.И. *ЖОрХ*. **2020**, *56*, 619–627. [Kharaneko A.O., Pekhtereva T.M., Kharaneko, O.I. *Russ. J. Org. Chem*. **2020**, *56*, 654–661.] doi 10.1134/S1070428020040144

8. Харанеко О.И., Богза С.Л. *ЖОрХ*. **2016**, *52*, 1049–1055. [Kharaneko A.O., Bogza S.L. *Russ. J. Org. Chem*. **2016**, *52*, 1043–1049.] doi 10.1134/S1070428016070228

9. Хабаров К.М., Харанеко О.И., Богза С.Л. *ХГС*. **2009**, *45*, 594–601. [Khabarov K.M., Kharaneko O.I., Bogza S.L. *Chem. Heterocycl. Compd*. **2009**, *45*, 468–474.] doi 10.1007/s10593-009-0280-0

10. Харанеко А.О. *ЖОрХ*. **2017**, *53*, 727–734. [Kharaneko O.I. *Russ. J. Org. Chem*. **2017**, *53*, 738–745.] doi 10.1134/S1070428017050153

11. Ересько А.Б., Толкунов В.С., Толкунов С.В. *ХГС*. **2010**, *46*, 1397–1403. [Eresko A.B., Tolkunov V.S., Tolkunov S.V. *Chem. Heterocycl. Compd*. **2010**, *46*, 1127–1132.] doi 10.1007/s10593-010-0637-4

Synthesis and Conversion of 3-Phenyl-1*H*-[1,4]oxasino-[4,3-*a*]benzimidazol-1-one into 4-Phenyl-2,5-dihydro-1*H*-[1,2,5]triazepino[5,4-*a*]benzimidazol-1-one

A. O. Kharaneko*, T. M. Pekhtereva and O. I. Kharaneko

Litvinenko Institute of Physical Organic and Coal Chemistry, ul. R. Luxemburg, 70, Donetsk, 83114 Ukraine
**e-mail:antonhar08@rambler.ru*

Received December 13, 2020; revised December 25, 2020; accepted December 26, 2020

The method for the synthesis of 3-phenyl-1*H*-[1,4]oxazino[4,3-*a*]benzimidazol-1-one, the first representative of a new heterocyclic system of benzimidazol-α-pyrones, was proposed, and its transformation into 4-phenyl-2,5-dihydro-1*H*-[1,2,5]triazepino[5,4-*a*]benzimidazol-1-one in reaction with hydrazine hydrate was studied.

Keywords: methyl 1-(2-oxo-2-phenylethyl)-1*H*-benzimidazole-2-carboxylate, 3-phenyl-1*H*-[1,4]oxazino[4,3-*a*]-benzimidazol-1-one, 2-(1*H*-benzimidazol-1-yl)-1-phenylethanone, 4-phenyl-2,5-dihydro-1*H*-[1,2,5]triazepino[5,4-*a*]benzimidazol-1-one, 3-phenylpyrazino[1,2-*a*] benzimidazol-1(2*H*)-one