NAMANGAN DAVLAT UNIVERSITETI
ILMIY AXBOROTNOMASI, [2026-9]
ISSN:2181-1458
ISSN:2181-0427

02.00.00-KIMYO FANLARI
journal.namdu.uz
CHEMICAL SCIENCES

2-GIDRAZINILBENZOKSAZOL ASOSIDA SULFONOGIDRAZIDLAR SINTEZI

Po‘latova Zulxumorxon Jalolidin qizi
Profi unversiteti, Tibbiy ba biologik kimyo kafedrasi PhD., v.v.b. dotsent
ORCID: 0000-0002-7355-6750
Tel: 91 010 72 44 E-mail: 7ulhumor@gmail.com

Annotatsiya. *Ushbu maqolada 2-gidrazinilbenzoksazolning turli o‘rinbosarli aromatik sulfoxloridlar bilan trietilamin ishtirokidagi arilsulfonillash reaksiyalari o‘rganildi. Reaksiyalar orqali arilsulfonil fragmentini saqlagan yangi geterotsiklik birikmalarni sintez qilish hamda ularning potensial biologik faolligini o‘rganish istiqbollari ko‘rib chiqildi.*

Kalit so‘zlar: *2-gidrazinilbenzoksazol, arilsulfonillash, aromatik sulfoxloridlar, trietilamin, sulfonamidlar, biologik faollik.*

СИНТЕЗ СУЛЬФОНОГИДРАЗИДОВ НА ОСНОВЕ 2-ГИДРАЗИНИЛБЕНЗОКСАЗОЛА

Аннотация. *В статье исследованы реакции арилсульфонилирования 2-гидразинилбензоксазола различными замещёнными ароматическими сульфонилхлоридами в присутствии триэтиламина. Рассмотрены возможности синтеза новых гетероциклических соединений, содержащих арилсульфонильный фрагмент, а также перспективы изучения их потенциальной биологической активности.*

Ключевые слова: *2-гидразинилбензоксазол, арилсульфонилирование, ароматические сульфонилхлориды, триэтиламин, сульфоамиды, биологическая активность.*

SYNTHESIS OF SULFONOHYDRAZIDES BASED ON 2-HYDRAZIN YLBENZOXAZOLE

Abstract. *This article investigates the arylsulfonylation reactions of 2-hydrazinylbenzoxazole with various substituted aromatic sulfonyl chlorides in the presence of triethylamine. The synthesis of new heterocyclic compounds containing an arylsulfonyl moiety and the prospects for investigating their potential biological activity are discussed.*

Keywords: *2-hydrazinylbenzoxazole, arylsulfonylation, aromatic sulfonyl chlorides, triethylamine, sulfonamides, biological activity.*

Kirish

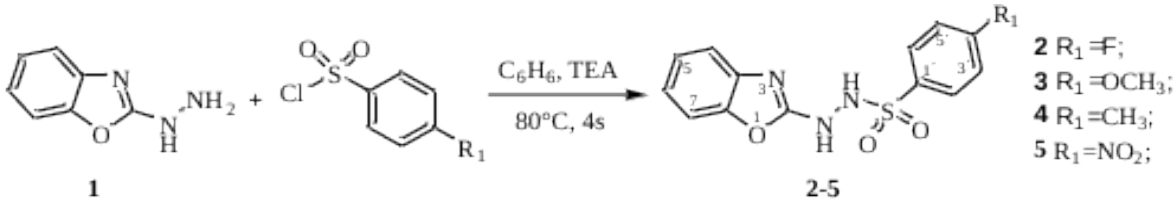
Ma’lumki, ikkilamchi ekzosiklik amino guruh saqlagan geterotsiklik birikmalar organik kimyoda muhim xomashyo hisoblanadi. Ular ishtirokida nafaqat alkillash va atsillash reaksiyalarini, balki muhim farmakofor fragmentlar bo‘lgan – arilsulfonil qoldig‘i saqlagan birikmalar olishda kerakli *bilding-bloklar* hisoblanadi. Shuningdek, sulfanilamidlar orasida mikrob va bakteriyalarga qarshi dori vositalari ko‘p uchraydi.

Adabiyotlar tahlili

Adabiyotlardan ma’lum bo‘ldiki, benzoksazolin hosilalarini sintez qilishda dastlabki mahsulot sifatida 2-aminofenol va uning turli o‘rinbosar saqlagan hosilalari keng va samarali qo‘llanilib kelinmoqda. Tadqiqotlarimizni molekulasida ikkita geteroatom tutgan dastlabki modda– 2-gidrazinilbenzoksazol (**1**) bilan amalga oshirish maqsadida 2-gidrazinilbenzoksazolni (**1**) turli xil aromatik sulfoxloridlar reaksiyalarini olib bordik [1, 100-106 b., 2, 142-143 b.].

Tadqiqot metodologiyasi

Shuning uchun, turli geterohalqa saqlagan sulfanilamidlarni sintez qilish, reaksiyalar borishiga ta’sir etuvchi omillarni aniqlash va olingan moddalar orasidan potensial biologik faol moddalar izlash maqsadida ekzosiklik amino guruh tutgan 2-gidrazinilbenzoksazolni (**1**) turli xil aromatik sulfoxloridlar: p-metoksibenzolsulfoxlorid, p-ftorbenzolsulfoxlorid, p-metilbenzolsulfoxlorid va p-nitrobenzolsulfoxlorid bilan trietilamin (kislota akseptori) ishtirokida arilsulfonillash reaksiyasi amalga oshirildi:



1 2-5

Natijalar va ularning tahlili

Arilsulfonillash reaksiyalari reagentlarning – **1** : arilsulfoxlorid : TEA – **1:1:2** nisbatdagi (ekvimolyar) miqdorini benzol eritmasida 80°C da trietilamin katalizatorligida 4 soat mobaynida qizdirilib olib borildi va "-NH-NH-SO_2- ko'prikli" yangi gibrid molekulalar (**2-5**) 63-90.5% unumlar bilan olindi [3; 506-508 b.] (1-jadval).

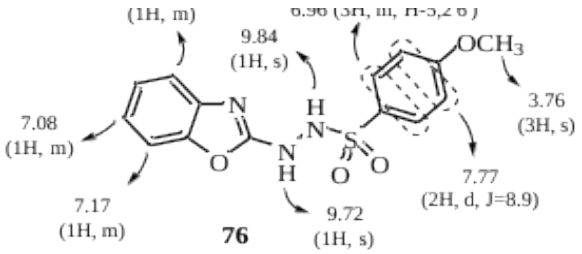
1-Jadval

Sintez qilingan birikmalarning (**2-5**) ba'zi fizik-kimyoviy kattaliklari

№	Brutto formula	R_f	Suyuq. har., °C	Unum, %
2	$C_{13}H_{10}N_3O_3SF$	0.55	215-217	90.5
3	$C_{14}H_{13}N_3O_4S$	0.50	228-230	86
4	$C_{14}H_{13}N_3O_3S$	0.49	278-280	63
5	$C_{13}H_{10}N_4O_5S$	0.46	208-210	82

***Sistema:** geksan : etilatsetat – 3:1

Tarkibida metoksi guruhi saqlagan birikma – **3**-moddaning ^{1}H YaMR spektri (CD_3OD + $CDCl_3$) ma'lumotlarida metoksi guruhi protonlari 3.79 m.u. da uch protonli singlet (3H, s) holida, yon zanjirdagi aromatik protonlar esa 7.77 (2H, d, J=8.9, H-2', 6'), 6.96 (3H, m, H-5, 3', 5') m.u. sohalarda o'ziga xos dublet va multiplet shaklidagi kimyoviy siljishlarga ega ekanligi aniqlandi. Molekulani ko'prik sifatida bog'lab turgan sulfogidrazinil fragmentidagi har ikkala imino guruh protonlarining 9.72 (1H, s, -NH-NH-SO_2-), 9.84 (1H, s, -NH-NH-SO_2-) m.u. sohalarda alohida bir protonli singlet signallari mavjud. Shuningdek, benzoksazol fragmentining aromatik protonlariga tegishli 7.08 (1H, m, H-6), 7.17 (1H, m, H-7), 7.21 (1H, m, H-4) m.u. sohalarda multiplet shaklidagi kimyoviy siljishlarning mavjudligi ushbu birikmaning tuzilishini to'liq tasdiqlaydi (2-rasm).



2-Rasm. **3**-Birikmaning ^{1}H YaMR spektr tahlili.

Kuzatilgan kimyoviy siljishlar va signallarning integral intensivliklari birikma tarkibida benzoksazol hamda arilsulfonil fragmentlari mavjudligiga mos keladi [4; 506-508 b, 5; 100 b, 6; 100-106 b, 7; 142-143 b].

Yangi sulfonogidrazidlarning olinishi (2-5) (***umumiy sintez usuli***)

500 ml hajmli tubi yumaloq kolbaga 1.34 mmol 2-gidrazinilbenzoksazol (**1**), ekvivalent nisbatda olingan sulfoxloridlar (4-ftorlbenzolsulfoxlorid, 4-metoksibenzolsulfoxlorid, 4-toluolsulfoxlorid, 4-nitrobenzolsulfoxlorid), 25.0 ml benzol va 2.68 mmol trietilamin solindi. Teskari sovutgich orqali moy hammomida 4 soat davomida 80°C haroratda qizdirildi. Reaksion aralashma xona haroratigacha sovutildi, erituvchi bug'latildi, qoldiq suv bilan bir necha marta yuvildi va quritildi. Olingan texnik mahsulot etanoldan qayta kristallanib **2-5** moddalar olindi.

N-(benzo[d]oksazol-2-il)-4-ftorbenzolsulfonogidrazid (2). 0.26 g 4-ftorbenzolsulfoxlorid ishtirokida yuqoridagi usulga muvofiq 0.41 g (90.5%) **2**-modda sintez qilindi, ssuyuq. har. 215-217°C **(etanol)**, R_f=0.55 (C). ^{1}H YaMR (600 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u., J/Gs): 6.98 (1H, td, J=8.9, 5.2, H-5), 7.08 (1H, td, J=8.9, 5.2, H-6), 7.17 (1H, d, J=7.5, H-7), 7.21 (1H, d, J=7.9, H-4), 7.24 (2H, t, J=8.7, H-3',5'), 7.92 (2H, dd, J=8.9, 5.2, H-2',6'), 9.95 (2H, keng.s, NH). ^{13}C YaMR (150 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u.): 165.97, 164.30, 135.68, 131.30, 128.47, 124.03, 121.36, 115.95, 109.25, 96.23, 79.35, 45.79, 40.63, 40.49, 40.35, 39.79. IQ spektr (KBr, v, sm^{-1}): 3313, 3005, 2742, 1661, 1590, 1341, 1154, 1092, 839, 744, 509, 427.

N-(benzo[d]oksazol-2-il)-4-metoksibenzolsulfonogidrazid (3). 0.28g 4-metoksibenzolsulfoxlorid ishtirokida yuqoridagi usul asosida 0.368 g (86%) **3**-modda olindi, suyuq. har. 228-230°C **(etanol)**, R_f=0.50 (C). ^{1}H YaMR (600 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u., J/Gs): 3.79 (3H, s, 4`-$OCH_3$), 6.96 (3H, m, H-5,3', 5'), 7.08 (1H, m, H-6), 7.17 (1H, m, H-7), 7.21 (1H, m, H-4), 7.77 (2H, d, J=8.9, H-2`,6`), 9.72 (1H, keng.s, NH), 9.84 (1H, keng.s, NH). ^{13}C YaMR (150 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u.): 163.10, 148.32, 130.49, 123.96, 122.21, 114.06, 109.16, 96.24, 56.71, 55.83, 40.64, 40.19, 39.81. IQ spektr (KBr, v, sm^{-1}): 3314, 300, 2723, 1660, 1589, 1334, 1155, 1026.92, 803.08, 745, 556, 506.

N-(benzo[d]oksazol-2-il)-4-metilbenzolsulfonogidrazid (4). 0.26g 4-toluolsulfoxlorid ishtirokida yuqoridagi usulga muvofiq 0.256 g (63%) **4**-modda sintez qilindi, suyuq. har. 278-280°C **(etanol)**, R_f=0.49 (C). ^{1}H YaMR (400 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u., J/Gs): 2.98 (3H, s, CH_3), 7.16 (4H, m, H-2', 6' 3', 5'), 6.93 (1H, t, J=7.73, H-4), 7.01 (1H, d, J=7.8, H-7), 7.70 (2H, m, H-5,6), 9.79 (1H, s, NH). ^{13}C YaMR (150 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u.): 148.47, 143.22, 136.61, 129.42, 128.38,

128.38, 123.94, 121.22, 109.21, 96.24, 40.81, 40.40, 39.56. IQ spektr (KBr, v, sm^{-1}): 3331, 2734, 1586, 1463, 1335, 1013, 715, 553, 426.

N-(benzo[d]oksazol-2-il)-4-nitrobenzolsulfonogidrazid (5). 0.29g 4-nitrobenzolsulfoxlorid ishtirokida yuqoridagi usul asosida 0.369 g (82%) **5**-modda olindi, suyuq. har. 208-210°C **(etanol)**, R_f=0.46 (C). ^{1}H YaMR (400 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u., J/Gs): 6.75 (1H, t, J=7.89, H-4), 6.86 (1H, d, J=9.54, H-7), 7.04 (2H, m, H-5,6), 7.12 (1H, t, J=7.29, H-2') 7.32 (2H, m, 7.2, H-3', 5'), 8.32 (1H, s, H-6'), 10.51 (1H, s, NH-NH-SO_2), 11.98 (1H, ,s, NH-NH-SO_2). ^{13}C YaMR (150 MGs, DMSO-d_6+CCl_4, δ, m.u.): 159.24, 148.38, 147.69, 124.30, 121.31, 119.64, 119.01, 116.38, 113.91, 109.46, 96.23, 79.43, 56.37, 18.94. IQ spektr (KBr, v, sm^{-1}): 3310, 2982, 2680, 1657, 1523, 1301, 1160, 1045, 850, 759, 510, 461.

SINTEZ QILINGAN BIRIKMALARNING BIOLOGIK FAOLLIGI

O'rganilgan adabiyot ma'lumotlari va tadqiqotlar asosida aytish mumkinki, benzoksazol hosilalari qatorida ko'pgina yuqori samarali preparatlar mavjud bo'lib, ular qishloq xo'jaligi, tibbiyot va veterinariyada qo'llanilib kelinmoqda.

Shuning uchun, sintez qilingan ba'zi moddalarni ingibitorlik, o'stiruvchanlik hamda sitotoksik faolliklarini o'rganishni maqsadga muvofiq deb topdik.

Obyekt sifatida tarkibida N- va S-atomlarida turli xil funksional guruhlar va fragmentlar saqlagan hosilalar tanlab olindi. Laboratoriya tadqiqotlari O'simlik moddalari kimyosi institutining "Dorivor va texnik o'simliklar biologiyasi" (Laboratoriya mudiri R.P. Zokirova) laboratoriyasida olib borildi.

O'stiruvchanlik faolligi

Tanlab olingan birikmalarning o'simliklarga nisbatan o'stiruvchanlik faolligiga doir izlanishlar bug'doyning "*Antonina*", bodringning "*Orzu*" navlarida birikmalarning 0.001%, 0.0001%, 0.00001% eritmalari tekshirildi. Etalon sifatida "*SILK ULTRA 60% KE*" stimulyatoridan foydalanildi. Nazorat sifatida preparatlar bilan ishlov berilmagan - suvda namlangan urug'lar ishlatilgan.

2-Jadvalda keltirilgan natijalar shuni ko'rsatadiki **2** va **3**-moddalari turli konsentratsiyalarda yuqori o'stiruvchanlik faollikni namoyon qildi.

2-Jadval 2-Gidrazinilbenzoksazol asosida olingan gidrazonlarning o'stiruvchanlik faolligi

Moddaning nomi	Sarf qilingan meyor, %	Bug'doy			Bodring		
		Unuvchanlk, % (3 kun)	Ildiz o`rtacha uzunligi, sm	O`simtaning o`rtacha uzunligi, sm	Unuvchanlik, % (3 kun)	Ildiz o`rtacha uzunligi, sm	O`simtaning o`rtacha uzunligi, sm
Nazorat	suv	65	2.24	1.90	60	2.00	1.00
SILK ULTRA (etalon) 60% KE	0.2%	100	3.01	2.74	90	0.87	0.63
2	0.001	90	4.16	3.35	90	3.48	1.42
	0.0001	90	4.87	3.81	80	4.36	1.99
	0.00001	100	5.45	4.10	90	4.38	2.10
3	0.001	95	4.25	3.87	90	3.62	1.57
	0.0001	100	5.86	4.89	95	3.86	1.66
	0.00001	100	**6.67**	**4.92**	100	5.23	2.56

Yuqoridagi moddalar bilan ishlov berilgan urug'larning unuvchanligi nazoratga nisbatan yuqori ekanligi aniqlandi. 2 va 3-moddalar 0.00001% li konsentratsiyalarda ishlov berilgan bug'doy o'simligi urug'larining unuvchanligi 100% ga teng bo'ldi. **3**-hosilalar ta'sirida bodring urug'larining unuvchanligi nazoratga nisbatan 35-40% yuqori natijani ko'rsatdi.

Xulosa. 2-Gidrazinilbenzoksazolning turli o'rinbosarli aromatik sulfoxloridlar bilan trietilamin ishtirokidagi arilsulfonillash reaksiyalari o'rganildi. Ushbu reaksiyalar geterotsiklik sulfonamid hosilalarini sintez qilish imkoniyatini ko'rsatdi. Mazkur birikmalar potensial biologik faol moddalarni izlash va keyingi tadqiqotlar uchun istiqbolli hisoblanadi.

Foydalanilgan adabiyotlar

1. Zh.J Pulatova, A.R. Khurramov, Kh.M. Bobakulov, B.Zh. Elmuradov. Interaction of substituted aminophenols with electrophilic reagents. Uzbekistan S.Yu Yunusov Institute of the Chemistry of Plant Substances "Actual problems of the chemistry of natural compounds" scientific conference of young scientists. Tashkent, March 17, 2022, p. 100

2. Z.Sh. Soporboyev, D.A. Dushamov. Karbamid, tiokarbamid va karbon kislotalar bilan o-almashgan aromatik aminlarning sikllanishi. *Oriental renaissance: Innovative, educational, natural and social sciences.*, 2024, 4/3, 100-106 b.

3. Z.J. Po‘latova, B.J. Elmuradov. Benzoksazollarning katalizatorsiz samarali sintezi. Urganch davlat universiteti “Maxalliy xomashyolar va ikkilamchi resusrslar asosidagi innovatsion texnologiyalari” respublika ilmiy-texnik anjumani materiallar to‘plami 1-jild Urganch 2021, 19-20-aprel, 142-143 b.

4. Z.J. Po‘latova, I.S. Ortikov, B.J. Elmuradov. N΄-(бензоксазол-2-ил)арилсульфоногидразидлар синтези. «Theoretical and experimental chemistry and modern Problems of chemical technology» Qarshi, 2023, 506-508 b.

5. Zh.J Pulatova, A.R. Khurramov, Kh.M. Bobakulov, B.Zh. Elmuradov. Interaction of substituted aminophenols with electrophilic reagents. Uzbekistan S.Yu Yunusov Institute of the Chemistry of Plant Substances “Actual problems of the chemistry of natural compounds” scientific conference of young scientists. Tashkent, March 17, 2022, p. 100

6. Z.Sh. Soporboyev, D.A. Dushamov. Karbamid, tiokarbamid va karbon kislotalar bilan o-almashgan aromatik aminlarning sikllanishi. *Oriental renaissance: Innovative, educational, natural and social sciences.*, 2024, 4/3, 100-106 b.

7. Z.J. Po‘latova, B.J. Elmuradov. Benzoksazollarning katalizatorsiz samarali sintezi. Urganch davlat universiteti “Maxalliy xomashyolar va ikkilamchi resusrslar asosidagi innovatsion texnologiyalari” respublika ilmiy-texnik anjumani materiallar to‘plami 1-jild Urganch 2021, 19-20-aprel, 142-143 b.