

Е. К. Панишева, Л. М. Алексеева, М. И. Евстратова,  
С. С. Киселев, В. Г. Граник

## СИНТЕЗ N-ЗАМЕЩЕННЫХ АМИНОМЕТИЛЕНБЕНЗОФУРАН-2-ОНОВ

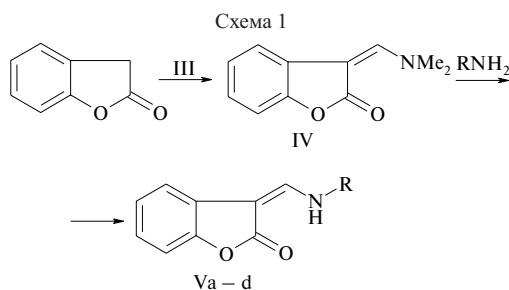
ФГУП Государственный научный центр "ГНЦА", Москва

Реакцией 3-[(диметиламино)метилена]- и 3-этоксиметиленабензофуран-2(3H)-она с различными аминопроизводными был получен ряд замещенных 3-R-аминометиленабензофуранонов, представляющих интерес в плане поиска биологически активных соединений.

Ранее нами подробно исследованы синтез и различные свойства и превращения производных оксидола I [1 – 5].

Настоящая работа посвящена изучению некоторых реакций функционализации оксааналогов бицикла I — бензофуран-2-она (II). На данном этапе исследования мы преследовали цель получить серию замещенных аминометиленабензофуран-2-онов и рассмотреть вопрос об оптимальных путях синтеза такого типа соединений. В качестве первого исходного соединения для этой цели был выбран 3-[(диметиламино)метилена]бензофуран-2(3H)-он (IV), гладко образующийся при взаимодействии лактона II с диметилацеталем диметилформамида (III).

Реакции переаминирования енаминолактона IV с высокоосновными и некоторыми ароматическими аминами протекают без осложнений и в результате получается серия аминометиленапроизводных V а-д (схема 1).



a, R = PhCH<sub>2</sub>; b, R = 1-бензилпиперидин-4-ил; c, R = Ph; d, R = 4-Me-OC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>; e, R = *p*-O<sub>2</sub>NC<sub>6</sub>H<sub>4</sub>

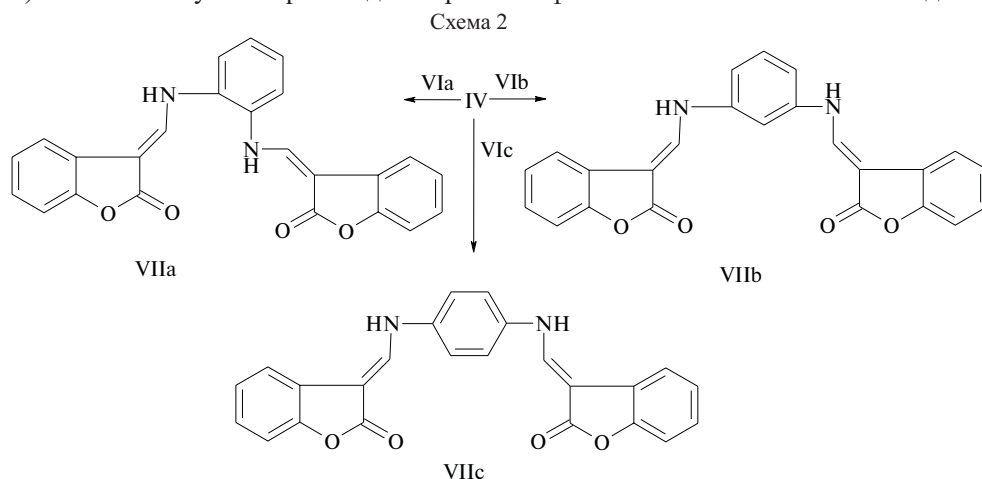
Иначе протекает реакция с *o*-, *m*- и *p*-фенилендиаминами (VIa – c) — в этих случаях происходит пере-

аминирование с участием обеих аминогрупп с образованием бис-соединений VIIa – c (схема 2).

В ходе изучения реакции переаминирования было замечено, что при выборе в качестве партнера для реакции с енамином IV аминов с весьма низкой основностью процесс затягивается на длительное время и требует более жестких условий, что в конечном итоге приводит к снижению выхода целевого продукта.

Ранее было показано [6], что при взаимодействии с нуклеофилами алкоксиметиленапроизводные проявляют существенно более высокую реакционную способность, чем амино- или диалкиламинометиленовые соединения. Для более четкого выяснения этого вопроса в настоящей работе были поставлены параллельные опыты между енамином IV и 3-этоксиметиленабензофуран-2(3H)-оном (VIII) с ароматическими аминами, в качестве которых были выбраны анилин, *n*-анизидин и *n*-нитроанилин. 3-Этоксиметиленабензофуран-2(3H)-он (VIII) был получен обычным методом [7], путем нагревания лактона II с ортомуравьиным эфиром в присутствии уксусного ангидрида.

Реакции соединений IV и VIII с анилином проводили в диметилформамиде. Соотношение исходных веществ и полученного продукта Vc определяли с помощью метода ВЭЖХ. Оказалось, что реакционная способность IV и VIII весьма сильно различается: если в первом случае реакция при комнатной температуре не идет вовсе, а при кипячении заканчивается через ≈ 3 ч, то во втором уже при выдержке реакционной массы в течение 2 ч при 25° С процесс протекает на ≈ 30 %, а через 0,5 ч кипячения заканчивается с образованием N-фениленамина Vc. С *n*-анизидином и анилином

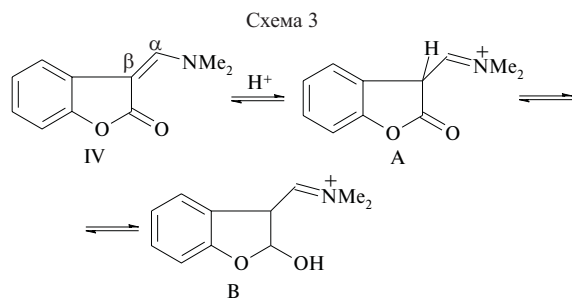


были проведены конкурентные реакции IV и VIII и установлено, что при кипячении в ДМФА этой смеси нарастает концентрация енамина VIII и при этом содержание в смеси исходного IV практически не меняется, в то время как за 2 ч концентрация VIII падает с 50 до 6 %, а в случае с анилином — с 50 до 27 %.

И, наконец, были проведены в тех же условиях реакции соединений IV и VIII с наименее основным из выбранных аминов — с *n*-нитроанилином. При кипячении смеси IV и *n*-нитроанилина в ДМФА в течение 5 ч содержание исходного IV снизилось от 100 до 80,4 % при образовании 19,6 % 3-[[4-нитрофенил)амино]метил]бензофуран-2(3H)-она (Ve). Изменение концентрации соединений VIII и Ve за то же время составило 100 % → 41,8 % и 0 % → 58,2 % соответственно. Все эти данные определенно указывают на значительно большую реакционную способность этоксиметиленпроизводного VIII сравнительно с 3-диметиламинометилпроизводным IV при проведении реакций образования енаминов в нейтральных условиях.

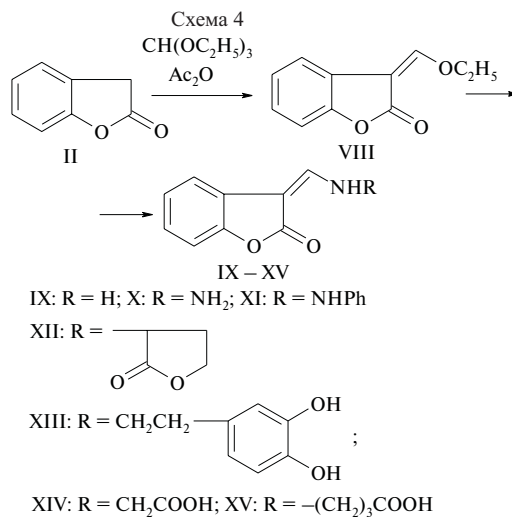
Интересные результаты получены при проведении реакций соединений IV и VIII с *n*-нитроанилином при кипячении компонентов в уксусной кислоте. В обоих случаях за 4 ч образуется 30,5 % продукта реакции Ve, т. е. в этих условиях реактивность енамина IV и этоксиметиленового соединения VIII уравнивается.

Объяснение этого факта основывается на известной способности енаминов образовывать при протонировании (в данном случае уксусной кислотой) иммониевые соли (A, B) [8], что применительно к нашему случаю выглядит следующим образом (схема 3).

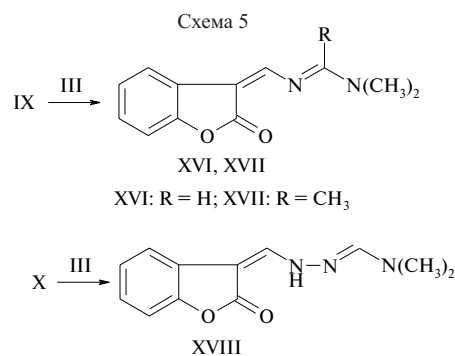


Понятно, что нуклеофильные реагенты существенно быстрее атакуют енаминовое  $\alpha$ -положение в случае иммониевых солей, чем при взаимодействии с нейтральными енаминами, и именно этим вызвано заметное повышение реакционной способности енамина IV, которая становится равной реакционной способности этоксиметиленпроизводного VIII.

Учитывая повышенную реакционную способность соединения VIII, именно его далее вводили в реакции с относительно малоосновными аминопроизводными, такими как гидразины, аминокислоты, находящиеся в цвиттер-ионной форме,  $\alpha$ -аминобутиролактоном. Взаимодействие с этими реагентами протекает гладко и в результате получены N-замещенные аминометиленбензофуран-2-оны IX – XV. Родоначальник ряда — аминометиленовое производное IX синтезировано реакцией VIII с аммиаком (схема 4).



Полученные соединения, имеющие в боковой цепи первичные аминогруппы IX, X, легко конденсируются с ацеталем ДМФА (III) с образованием соответствующих замещенных N,N-диметилформамидинов XVI – XVIII (схема 5).



Таким образом, на основе бензофуран-2-она (II) синтезирована большая группа замещенных 3-аминометиленбензофуранонов, представляющих интерес для дальнейшей функционализации, направленной на поиск новых биологически активных веществ. Показано, что синтез этих соединений может быть осуществлен на основе аминаолактона — 3-[(диметиламино)метил]бензофуран-2(3H)-она (IV) или 3-(этоксиметилен)бензофуран-2(3H)-она (VIII), причем для последнего характерна более высокая реакционная способность по отношению к нуклеофильным реагентам.

#### Экспериментальная часть

Спектры ПМР получены на спектрометре AC-300 (“Bruker”). Для тонкослойной хроматографии использовали пластинки “TLC aluminium sheets Silika gel 60 F<sub>254</sub>” (MERCK) с проявлением в УФ-свете. Контроль реакций методом ТСХ проводили в системе бензол-метанол, 9:2, в бензоле и ЭА. Масс-спектры соединений сняты на приборе “Waters Micromass” 2Q 2000.

Для анализа реакционных масс методом ВЭЖХ использовалась система “Water Breeze”, состоящая из градиентного насоса Waters 1525, двухволнового детектора Waters 2487, ручного инжектора Rheodyne. Программное обеспечение — Empower, аналитическая колонка Phenomenex Luna C 18 (2), 150 × 4,6 мм,

детектор УФ 254 нм, скорость потока 1 мл/мин, температура колонки 20 °С, время разделения 20 мин. Подвижная фаза — ацетонитрил – водный буфер, 50:50. Буфер готовили добавлением *n*-пропиламина к 0,01 % водному раствору муравьиной кислоты до рН 5,2. Пробы исследованных соединений готовили растворением соответствующих образцов в ацетонитриле (время удерживания см. табл. 1). Пробы реакционных масс готовили разбавлением ацетонитрилом до концентрации исходного соединения 15 – 20 мг/л. Характеристики соединений приведены в табл. 2. Данные элементного анализа соответствуют приведенным брутто-формулам.

**3-[(Диметиламино)метил]бензофуран-2-(3Н)-он (IV).** Смесь 0,4 г (3 ммоль) бензофуранона-2 (II), 0,71 г (6 ммоль) диметилацетата диметилформамида (III) в 3 мл изопропанола перемешивают 1 ч при 20 °С. Выделившийся осадок IV отфильтровывают, промывают изопропанолом, петролейным эфиром и сушат. Смесь E, Z-изомеров (1:1), ПМР-спектр (ДМСО-*d*<sub>6</sub>), δ, м. д.: 3,33, 3,37, 3,55 с (6H, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>), 7,00, 7,34, 7,48 м (4H, 4-7-H), 7,58, 7,83 с (1H, 1'-H).

**3-[(Бензиламино)метил]бензофуран-2-(3Н)-он (Va), 3-[[1-(1-бензилпиперидин-4-ил)амино]метил]бензофуран-2-(3Н)-он (Vb), 3[(Фениламино)метил]бензофуран-2-(3Н)-он (Vc), 3-[[4-(метоксифенил)амино]метил]бензофуран-2-(3Н)-он (Vd).** К раствору 0,5 ммоль соединения IV в 2 мл уксусной кислоты прибавляют 1,5 ммоль соответствующего амина (a, b, c, d), кипятят 2 ч, охлаждают. Выделившиеся осадки Va, Vb, Vc, Vd отфильтровывают, промывают изопропанолом, петролейным эфиром и сушат. В случае соединений Vc и Vd реакционный раствор кипятят 30 мин при получении Vb в качестве растворителя используют диметилформамид. Соединение Vd. Смесь E, Z-изомеров (1:1), ПМР-спектр (ДМСО-*d*<sub>6</sub>), δ, м. д.: 3,73 с (3H, OCH<sub>3</sub>), 6,89 – 7,26, 7,42, 7,45, 7,65, 8,06 м (4H, 4-7-H), 7,87, 8,64 с, д (1H, 1'-H, J = 13,3 Гц), 9,86, 10,18 уш. с, уш. д (1H, NH, J = 13,3 Гц).

**3,3'-[(1, 2-Фенилен)бис(иминометил)]бисбензофуран-2-(3Н)-он (VIIa), 3,3'-[(1, 3-фенилен)бис(иминометил)]бисбензофуран-2-(3Н)-он (VIIb) и 3,3'-[(1, 4-фенилен)бис(иминометил)]бисбензофуран-2-(3Н)-он (VIIc).** Смесь 1 ммоль соединения IV, 0,5 ммоль соответствующего фенилендиамина VIa – c в 3 мл уксусной кислоты кипятят 8 ч, оставляют на ночь. Выделившийся осадок отфильтровывают, промывают изопропанолом, петролейным эфиром и сушат. В случае получения соединения VIIc реакционный раствор кипятят 2 ч.

Таблица 1

Времена удерживания соединений IV, V, VIII (ВЭЖХ)

Соединение	Время удерживания, мин
IV	3,6
Vc	18,2
Ve	19,7
Vd	18,9
VIII	9,1

**3-(Этоксиметил)бензофуран-2-(3Н)-он (VIII).** Смесь 0,2 г (1,5 ммоль) бензофуранона-2 (II), 0,66 г (4,5 ммоль) триэтилортоформиата и 1 мл уксусного ангидрида кипятят 1 ч. Реакционный раствор частично упаривают в вакууме, остаток охлаждают. Выделившийся осадок соединения VIII отфильтровывают, промывают водой, изопропанолом, петролейным эфиром и сушат. ПМР-спектр (ДМСО-*d*<sub>6</sub>), δ, м. д.: 1,39, 4,47 т, д (по 3H и 2H, J = 7,2 Гц, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>); 7,16, 7,27, 7,55 все м (по 2H, 1H, 1H, 4-7-H), 8,04 с (1H, CH).

**3-(Аминометил)бензофуран-2-(3Н)-он (IX).** К 0,5 г (2,5 ммоль) соединения VIII прибавляют 50 мл водного аммиака. Реакционную смесь оставляют при комнатной температуре в течение 2 – 3 ч. Осадок соединения IX отфильтровывают, промывают изопропанолом, петролейным эфиром и сушат.

**3-(Гидразинметил)бензофуран-2-(3Н)-он (X) и 3-[(N'-Фенилгидразин)метил]бензофуран-2-(3Н)-он (XI).** Растворяют при нагревании 0,1 г (0,5 ммоль) соединения VIII в 2 мл этилового спирта, добавляют 0,5 ммоль соответствующего гидразина, через 5 – 10 мин выделившийся осадок охлаждают, отфильтровывают, промывают этиловым спиртом, петролейным эфиром и сушат.

Соединение X. Смесь E, Z-изомеров (2:3), ПМР-спектр (ДМСО-*d*<sub>6</sub>), δ, м. д.: 5,29 уш. с (2H, NH<sub>2</sub>), 6,75, 7,35, 7,66 м (4H, 4-7-H), 7,62, 8,05 оба д (1H, CH, J = 11,4 Гц), 9,49, 9,58 оба уш. д (1H, NH, J = 11,4 Гц).

Соединение XI. Смесь E, Z-изомеров (1:3), ПМР-спектр (ДМСО-*d*<sub>6</sub>), δ, м. д.: 6,76 – 7,27, 7,58 все м (9H, Ph, 4-7-H), 7,58, 8,00 оба д (1H, CH, J = 11,7 Гц), 8,57, 8,72 оба с (1H, NHPh), 9,95, 10,05 оба уш. д (1H, NH).

**3-[[2-Оксотетрагидрофуран-3-ил)амино]метил]бензофуран-2-(3Н)-он (XII).** Смесь 0,1 г (0,5 ммоль)

Таблица 2

Физико-химические свойства синтезированных соединений

Соединение	Выход, %	Т. пл., °С (растворитель)	M <sup>+</sup>	Брутто-формула
IV	71,4	141 – 142 (ИПС)	189	C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> NO <sub>2</sub>
Va	84,6	174 – 175 (ИПС)	251	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>2</sub>
Vb	77	177 – 178 (абс. спирт)	334	C <sub>21</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
Vc	34	164 – 165 (ИПС)	237	C <sub>15</sub> H <sub>11</sub> NO <sub>2</sub>
Vd	57,1	176 – 177 (ИПС)	267	C <sub>16</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>3</sub>
VIIa	7,5	259 – 260 (MeOH-диоксан)	396	C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
VIIb	15	335 – 337 (ДМФА)	396	C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
VIIc	30	333 – 335 (ДМФА)	396	C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
VIII	71,4	102 – 103 (ИПС)	190	C <sub>11</sub> H <sub>10</sub> O <sub>3</sub>
IX	63,1	176 – 177 (CH <sub>3</sub> CN)	161	C <sub>9</sub> H <sub>7</sub> NO <sub>2</sub>
X	66,7	246 – 247 (MeOH)	176	C <sub>9</sub> H <sub>8</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
XI	84,6	192 – 193 (CH <sub>3</sub> CN)	252	C <sub>15</sub> H <sub>12</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
XII	58,3	196 – 197 (ИПС)	245	C <sub>13</sub> H <sub>11</sub> NO <sub>4</sub>
XIII	67	199 – 200 (ИПС)	297	C <sub>17</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>4</sub>
XIV	40	213 – 214 (MeOH)	219	C <sub>11</sub> H <sub>9</sub> NO <sub>4</sub>
XV	45,1	155 – 156 (ИПС)	247	C <sub>13</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>4</sub>
XVI	74,8	225 – 226 (CH <sub>3</sub> CN)	216	C <sub>12</sub> H <sub>12</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
XVII	74	184 – 185 (ИПС)	230	C <sub>13</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
XVIII	56,4	194 – 195 (MeOH)	231	C <sub>12</sub> H <sub>13</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>

соединения VIII, 0,11 г (0,6 ммоль) 2-амино-4-бутиролактона гидробромида, 0,06 г (0,6 ммоль) триэтиламина в 2 мл диметилформамида кипятят 1 ч. Реакционный раствор упаривают в вакууме, к остатку добавляют несколько капель изопропанола, охлаждают, выделившийся осадок соединения XII отфильтровывают, промывают водой, изопропанолом, петролевым эфиром и сушат. Смесь E,Z-изомеров (2:3), ПМР-спектр (ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 2,53, 4,25, 4,43, 4,65, 4,85 все м (5H, протоны тетрагидрофуранона) 6,95 – 7,19, 7,40, 7,77 все м (4H, 4 – 7-H), 7,71, 8,13 оба д (1H, CH, J = 13,8 Гц), 8,22, 8,81 оба квд (1H, NH).

**3-[[2-(3,4-Дигидроксифенил)этил]амино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XIII).** Смесь 0,1 г (0,5 ммоль) соединения VIII, 0,11 г (0,6 ммоль) дофамина, 0,06 г (0,6 ммоль) триэтиламина в 2 мл диметилформамида кипятят 5 мин, охлаждают, выделившееся соединение XIII отфильтровывают, промывают водой, изопропанолом, петролевым эфиром и сушат. Смесь E,Z-изомеров (1:1), ПМР-спектр (ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 2,73, 3,56 т, квт (по 2H, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>, J = 6,1 Гц), 6,49, 6,63, 6,70 – 7,08, 7,34, 7,76 м (7H, 4-7-H, дигидроксифенил), 7,57, 8,04 д, д (1H, CH, J = 14,5 Гц), 8,22, 8,65 уш. д, тр (1H, NH, J<sub>1</sub> = 14,5 Гц, J<sub>2</sub> = 6,1 Гц), 8,70, 8,75 уш. с (1H, OH, OH).

**3-[[Карбоксиметил]амино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XIV).** Смесь 0,02 г (0,5 ммоль) гидроксида натрия, 0,04 г (0,5 ммоль) аминокислоты в 5 мл абс. этилового спирта кипятят 15 мин, добавляют 0,1 г (0,5 ммоль) соединения VIII, продолжают кипятить еще 5 – 10 мин. Реакционную массу охлаждают, натриевую соль отфильтровывают, промывают абсолютным этиловым спиртом. Натриевую соль растворяют в минимальном количестве воды и при 0 – 5 °С подкисляют соляной кислотой. Выделившийся осадок соединения XIV отфильтровывают, промывают водой, изопропанолом и сушат. Смесь E,Z-изомеров (1:1), ПМР-спектр (ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 4,18, 4,20 оба д (по 2H, CH<sub>2</sub>, J = 6,1 Гц), 6,92 – 7,28, 7,34, 7,21 м (4H, 4-7-H), 7,56, 8,16 д, д (1H, CH, J = 14,5 Гц), 8,21, 8,62 уш. д тр (1H, NH, J<sub>1</sub> = 14,5 Гц, J<sub>2</sub> = 6,1 Гц).

**3-[[3-Карбоксипропил]амино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XV).** Смесь 0,1 г (0,5 ммоль) соединения VIII, 0,06 г (0,5 ммоль) γ-аминомасляной кислоты в 3 мл диметилформамида кипятят до полного растворения кислоты. Растворитель упаривают в вакууме, добавляют минимальное количество изопропанола, охлаждают, отфильтровывают, промывают изопропанолом и сушат. Смесь E,Z-изомеров (1:1), ПМР-спектр

(ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 1,83, 2,28, 3,44 все м (по 2H, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>), 6,92 – 7,15, 7,37, 7,78 м (4H, 4-7-H), 7,62, 8,11 д, д (1H, CH, J = 14,5 Гц), 8,67, 8,93, уш. д тр (1H, NH, J<sub>1</sub> = 14,5 Гц, J<sub>2</sub> = 6,1 Гц).

**3-[[N'-(Диметиламино)метилен]амино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XVI).** Смесь 0,8 г (5 ммоль) соединения IX, 1,19 г (10 ммоль) ацетата диметилформамида (III) в 32 мл ацетонитрила кипятят 5 мин, реакционный раствор охлаждают. Выделившееся соединение XVI отфильтровывают, промывают ацетонитрилом и сушат. ПМР-спектр (ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 3,20, 3,21 оба с (по 3H, N(Me)<sub>2</sub>), 6,61 – 6,70, 6,87, 7,23 оба м (по 3H, 1H, 4-7-H), 8,12 с (1H, CHNH), 8,36 с (1H, N=CHN(Me)<sub>2</sub>).

**3-[[N'-(Диметиламино)этилиден]амино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XVII).** Смесь 0,4 г (2,5 ммоль) соединения IX, 1 г (6 ммоль) ацетата ацетамида в 28 мл ацетонитрила кипятят 15 мин, реакционный раствор упаривают в вакууме. К остатку добавляют изопропанол, охлаждают, отфильтровывают, промывают изопропанолом и сушат. ПМР-спектр (ДМСО-d<sub>6</sub>), δ, м. д.: 2,34 с (3H, CH<sub>3</sub>), 3,31, 3,38 оба с (по 3H, N(Me)<sub>2</sub>), 7,03, 7,80 оба м (по 3H, 4-7-H), 8,17 с (1H, CHNH).

**3-[[N'-(Диметиламино)метилен]гидразино]метилен]бензофуран-2-(3H)-он (XVIII).** Смесь 0,6 г (3 ммоль) соединения X, 0,8 г (6 ммоль) ацетата диметилформамида (III) в 24 мл ацетонитрила кипятят 10 мин. Реакционный раствор упаривают в вакууме, к остатку добавляют изопропанол, охлаждают, отфильтровывают соединение XVIII, промывают изопропанолом и сушат.

## ЛИТЕРАТУРА

1. В. Г. Граник, С. Ю. Рябова, Т. В. Головки, *Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов*, В. Г. Карцев (ред.), IBS PRESS, Москва (2003), сс. 91 – 117.
2. Т. В. Головки, Н. П. Соловьева, Г. А. Богданова и др., *Химия гетероцикл. соедин.*, № 9, 1190 – 1198 (1991).
3. И. П. Исакович, С. Ю. Рябова, Л. М. Алексеева и др., *Хим.-фарм. журн.*, **29**(2), 25 – 26 (1995).
4. Т. В. Головки, Н. П. Соловьева, О. С. Анисимова, *Химия гетероцикл. соедин.*, **33**(10), 1347 – 1355 (1999).
5. В. Г. Граник, И. П. Граевская, С. Ю. Рябова, *Хим.-фарм. журн.*, **31**(12), 20 – 35 (1997).
6. В. Г. Граник, Е. Н. Дозорова, Н. Б. Марченко, *Хим.-фарм. журн.*, **21**(10), 1249 – 1253 (1987).
7. Л. Физер, М. Физер, *Реагенты для органического синтеза*, Мир, Москва (1970), т. III, сс. 33 – 40.
8. В. Г. Граник, В. П. Костюченко, В. Г. Смирнова и др., *Ж. орган. химии*, **9**, 2299 – 2302 (1973).

Поступила 25.12.06

## SYNTHESIS OF N-SUBSTITUTED AMINOMETHYLENE-BENZOFURAN-2-ONES

E. K. Panisheva, L. M. Alekseeva, M. I. Evstratova, S. S. Kiselev, and V. G. Granik\*

State Scientific Center for Antibiotics, Moscow, 117105 Russia  
e-mail: vggranik@mail.ru

A series of substituted 3-R-aminomethylenebenzofuranones have been via the reactions of 3-[(dimethylamino)methylene- and 3-ethoxymethylene]benzofuran-2(3H)-one with various amino derivatives. The synthesized compounds offer a promising basis in the search for biologically active substances.