

Т. П. Глущенко, В. И. Гончаров^а, А. В. Аксенов

ИССЛЕДОВАНИЯ В ОБЛАСТИ 2,3'-БИХИНОЛИНА

23*. СИНТЕЗ 1'-R-1',4'-ДИГИДРО-2,3'-БИХИНОЛИН-4'-ОНОВ
КОНДЕНСАЦИЕЙ КЛЯЙЗЕНА

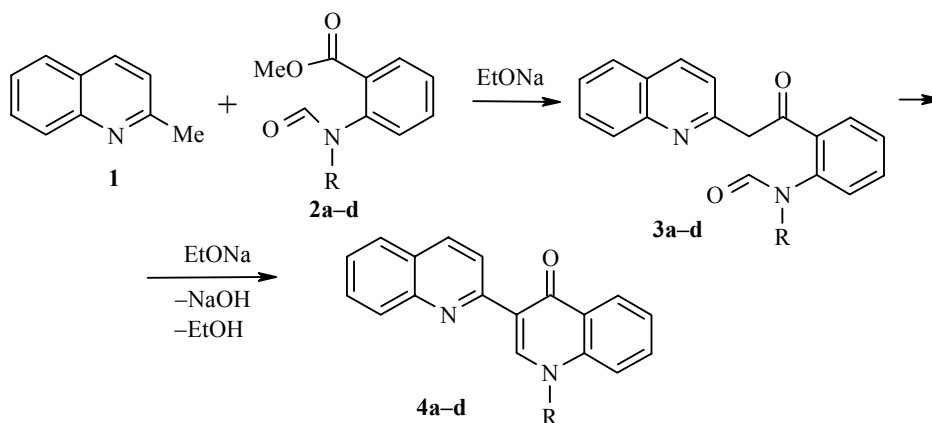
Разработан метод синтеза 1'-R-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-онов, основанный на взаимодействии хинальдина с метиловыми эфирами N-алкил-N-формилантралиловых кислот в условиях конденсации Кляйзена.

Ключевые слова: 2,3'-бихинолины, 1'-R-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-оны, метиловые эфиры N-алкил-N-формилантралиловых кислот, конденсация Кляйзена, циклизация.

Ранее был разработан ряд методов синтеза 1'-R-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-онов **4**, основанных на гидроксировании солей бихинолина [2], окислении полициклических соединений [3, 4]. Одностадийные методы синтеза этих соединений, исходя из простых производных хинолина, не были известны, поэтому мы разработали такой метод синтеза, основанный на конденсации Кляйзена.

Подобное превращение недавно было описано для синтеза 3-гетарилхромонов [5]. Мы показали, что хинолоны **4** можно получить кипячением в этаноле в присутствии этилата натрия хинальдина (**1**) и метиловых эфиров N-алкил-N-формилантралиловых кислот **2**.

Вероятно, реакция включает ацилирование хинальдина и последующую внутримолекулярную конденсацию промежуточного кетона **3**.



2-4 a R = Me, b R = Et, c R = Bu, d R = CH₂Ph

* Сообщение 22 см. [1].

Попытка осуществить эту реакцию, используя в качестве исходных соединений метиловых эфиров N-ацетил- и N-бензоилантралиловых кислот не увенчалась успехом.

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Спектры ЯМР записаны на приборе Bruker WP-200 (200 МГц), внутренний стандарт ТМС. Масс-спектры записаны на приборе МАТ-311А. Контроль за протеканием реакций и индивидуальностью синтезированных соединений осуществляли на пластинках Silufol UV-254, система растворителей этилацетат–петролейный эфир, 1 : 1.

Синтез 1'-R-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-онов (общая методика). К раствору этилата натрия, полученному растворением 0.046 г (2 ммоль) натрия в 10 мл абсолютного этанола, осторожно добавляют 0.14 г (1 ммоль) хинальдина, перемешивают 15 мин и добавляют 1 ммоль метилового эфира замещенной антралиловой кислоты. Смесь перемешивают 15 мин и затем кипятят 5 ч, выливают в 50 мл воды. Осадок отфильтровывают, сушат.

1'-Метил-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-он (4a, C₁₉H₁₄N₂O). Выход 0.146 г (51%). Т. пл. 193–194 °С [2]. Проба смешения с заводом известным образцом не дает депрессии температуры плавления. Спектр ЯМР ¹H идентичен приведенному в работе [2].

1'-Этил-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-он (4b, C₂₀H₁₆N₂O). Выход 0.15 г (50%). Т. пл. 139–140 °С (из бензола), т. пл. 139–140 °С [2]. Проба смешения с заводом известным образцом не дает депрессии температуры плавления. Спектр ЯМР ¹H идентичен приведенному в работе [2].

1'-Бутил-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-он (4c, C₂₂H₂₀N₂O). Выход 0.157 г (48%). Т. пл. 125–126 °С (из бензола), т. пл. 125–126 °С [2]. Проба смешения с заводом известным образцом не дает депрессии температуры плавления. Спектр ЯМР ¹H идентичен приведенному в работе [2].

1'-Бензил-1',4'-дигидро-2,3'-бихинолин-4'-он (4d, C₂₅H₁₈N₂O). Выход 0.065 г (18%). Т. пл. 171–172 °С (из бензола), т. пл. 171–172 °С [2]. Проба смешения с заводом известным образцом не дает депрессии температуры плавления. Спектр ЯМР ¹H идентичен приведенному в работе [2].

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Д. В. Моисеев, В. И. Гончаров, А. В. Аксенов, *ХГС*, 848 (2007). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **43**, 715 (2007)].
2. О. Н. Надеин, А. В. Аксенов, *ХГС*, 942 (2001). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **37**, 867 (2001)].
3. F. Kröhnke, H. Dickhäuser, I. Vogt, *Liebigs Ann. Chem.*, **644**, 93 (1961).
4. S. Niementowski, *Ber.*, **39**, 385 (1906).
5. В. Г. Пивоваренко, В. П. Хиля, *ХГС*, 625 (1991). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **27**, 496 (1991)].

Ставропольский государственный университет,
Ставрополь 355009, Россия
e-mail: biochem-org@stavsru

Поступило 04.10.2007

^aСтавропольская государственная медицинская
академия, Ставрополь 355017, Россия
e-mail: sigma@statel.stavropol.ru