

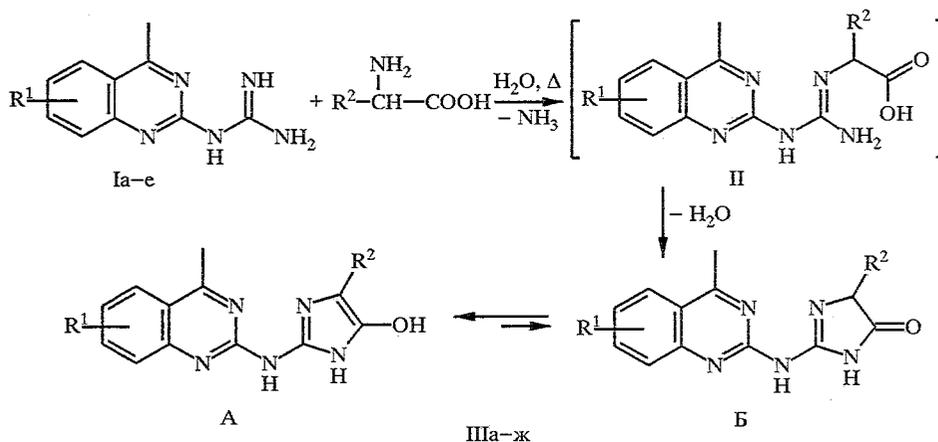
Х. С. Шихалиев, А. В. Фалалеев, Г. И. Ермолова, А. С. Соловьев

ХИНАЗОЛИЛ-2-ГУАНИДИНЫ
В РЕАКЦИЯХ ГЕТЕРОЦИКЛИЗАЦИИ

1. ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С АМИНОКИСЛОТАМИ

Конденсацией 6(7)-R-4-метилхиназолил-2-гуанидинов с α -аминокислотами синтезированы 2-гидроксиимидазолы, а с антралиновой кислотой — соответствующие 4-гидроксихиназолины.

Нами установлено, что 6(7)-R-4-метилхиназолил-2-гуанидины Ia—e легко конденсируются с α -аминокислотами при кипячении в воде. Реакция идет по гуанидиновому фрагменту с выделением аммиака через промежуточное образование иминокислот II. Последние циклизуются с отщеплением воды в соответствующие 2-[6(7)-R¹-4-метилхиназолил-2]амино-5-гидрокси-4-R²-имидазолы IIIa—e. На существование последних в гидроксиформе (А), а не в оксоформе (Б) указывают данные спектров ПМР



I—III a, ж R¹ = H, б R¹ = 6-Me, в R¹ = 6-OMe, г R¹ = 6-OEt, д R¹ = 7-Me, e R¹ = 7-OMe,
a—e R² = H, ж R² = CH₂Ph

(табл. 1), в которых отсутствуют сигналы протонов метиленовых или метиновых (в случае IIIж) групп имидазолинового фрагмента.

Аналогично протекает реакция 2-гуанидинохиназолинов Ia—e с антралиновой кислотой. В этом случае продуктами циклизации являются соответствующие 2-[6(7)-R-4-метилхиназолил-2]амино-4-гидроксихиназолины IVa—e.

4-Гидроксиформа соединений IVa—e согласуется с литературными данными [1, 2] и подтверждается спектрами ПМР (табл. 1), в которых наблюдается сигнал протона только одной группы NH, а сигнал группы OH смещен в слабое поле и перекрывается мультиплетом ароматических протонов.

Характеристики хиназолиламиноимидазолов и хиназолиламинохиназолинов

Соединение	Брутто-формула	Найдено, % Вычислено, %				Т _{пл} , °С	Выход, %
		М*	С	Н	N		
Ша	C ₁₂ H ₁₁ N ₅ O	241	59,75	4,56	29,05	244...246	56
		241,25	59,57	4,71	28,93		
Шб	C ₁₃ H ₁₃ N ₅ O	255	61,18	5,10	27,45	269...271	66
		255,27	61,31	5,03	27,32		
Шв	C ₁₃ H ₁₃ N ₅ O ₂	271	57,56	4,80	25,83	>350	71
		271,27	57,37	4,66	26,00		
Шг	C ₁₄ H ₁₅ N ₅ O ₂	285	58,95	5,26	24,56	244...246	55
		285,31	58,90	5,38	24,46		
Шд	C ₁₃ H ₁₃ N ₅ O	255	61,18	5,10	27,45	199...201	81
		255,27	61,34	4,92	27,37		
Ше	C ₁₃ H ₁₃ N ₅ O ₂	271	57,56	4,80	25,83	258...260	70
		271,27	57,47	4,94	25,77		
Шж	C ₁₉ H ₁₇ N ₅ O	330	69,09	4,85	21,21	234...236	27
		330,37	69,21	4,72	21,30		
Ivа	C ₁₇ H ₁₃ N ₅ O	303	67,33	4,29	23,10	255...257	20
		303,32	67,17	4,46	23,16		
Ivб	C ₁₈ H ₁₅ N ₅ O	317	68,14	4,73	22,08	205...207	50
		317,35	68,29	4,60	22,23		
Ivв	C ₁₈ H ₁₅ N ₅ O ₂	333	64,86	4,51	21,02	315...316	46
		333,35	65,00	4,39	21,20		
Ivг	C ₁₉ H ₁₇ N ₅ O ₂	347	65,71	4,90	20,17	198...200	37
		347,37	65,88	4,83	20,18		
Ivд	C ₁₈ H ₁₅ N ₅ O	317	68,14	4,73	22,08	265...267	29
		317,35	68,29	4,85	22,10		
Ive	C ₁₈ H ₁₅ N ₅ O ₂	333	64,87	4,51	21,02	224...226	41
		333,35	65,00	4,39	21,13		

Исходные 6(7)-R-4-метилхиназолил-2-гуанидины Ia—e синтезированы по известной методике [2].

2-[6(7)-R-4-Метилхиназолил-2]амино-5-гидрокси-4-R²-имидазолы (Ша—ж). Смесь 0,01 моль соответствующего хиназолилгуанидина Ia—e и 0,012 моль α-аминокислоты в 100 мл воды кипятят 4...6 ч, охлаждают, осадок продукта Ш отфильтровывают и перекристаллизовывают из диоксана.

2-[6(7)-R-4-Метилхиназолил-2]амино-4-гидроксихиназолины (Ivа—e). Смесь 0,01 моль соответствующего хиназолилгуанидина Ia—e и 0,01 моль антралиновой кислоты в 30 мл диметилсульфоксида выдерживают при 100 °С 8...10 ч, охлаждают, выливают в воду, осадок продукта Iv отфильтровывают и перекристаллизовывают из диоксана.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Meyer J. F., Wagner E. C. // J. Org. Chem. — 1943. — Vol. 8. — P. 239.
2. Brown J. P. // J. Chem. Soc. C. — 1968. — N 9. — P. 1074.
3. Sengupta S. K., Chatterjee S., Protopapa H. K. // J. Org. Chem. — 1972. — Vol. 37. — P. 1323.