РЕАКЦИЯ ЕНАМИНОАМИДОВ РЯДА 1,2,3,4-ТЕТРАГИДРОИЗОХИНОЛИНА С МАЛОНИЛДИХЛОРИДОМ

Ключевые слова: енаминоамиды ряда 1,2,3,4-тетрагидроизохинолина, малонилдихлорид, 6,6-диметил-1-(N-морфолинокарбонил)-2,3,4,5,6,7-гексагидро- бензо[h]хинолизин-2,3-дион, 2,2-диметил-6-(N-морфолинокарбонил)-1,2,3,4,5,6- гексагидронафто[1,2-h]хинолизин-3,4-дион

Ранее была показана возможность построения системы азахризена реакцией енаминов ряда бензо[f]изохинолина с акрилоилхлоридом [1]. Продолжая наши исследования в данной области, мы решили исполь- зовать в качестве ацилирующего средства малонилдихлорид. Реакции этого хлорангидрида с енаминами до настоящего времени практически неизвестны.

Исследования показали, что енаминоамид 1 [2] при кипячении с мало- нилдихлоридом в бензоле в присутствии триэтиламина образует трициклический дикетон 2. Реакция малонилдихлорида с аналогичным соединением ряда бензо[f]изохинолина приводит к тетрациклическому дикетону 3.

 β -Дикарбонильные соединения **2** и **3** можно рассматривать в качестве новых синтонов и потенциальных лекарственных веществ.

Спектры ЯМР 1 Н зарегистрированы на приборе Bruker-300 (300 МГц) в CDCl₃, внутренний стандарт ГМДС. ИК спектры записаны на спектрометре Specord M-80 в вазелиновом масле, масс-спектры – на приборе МАТ-311(70 эВ, ЭУ).

6,6-Диметил-1-(N-морфолинокарбонил)-2,3,4,5,6,7-гексагидробензо[*h*]хино- лизин-2,3-дион (2). К раствору 3.40 г (10 ммоль) соединения 1 и 1.5 мл (11 ммоль) триэтиламна в 100 мл бензола прибавляют 1.41 г (10 ммоль) малонилдихлорида. Выпавший осадок гидрохлорида триэтиламина отфильтро- вывают. Реакционную смесь кипятят еще 1 ч, при этом раствор продолжает слегка мутнеть. После охлаждения до 20 °C смесь разбавляют 150 мл гексана, выпавший осадок отфильтровывают, сушат и перекристаллизовывают из гексана. Выход 62 %. Т. пл. 78 – 80 °C. ИК спектр, v, см $^{-1}$: 1630 (C=O кетона), 1675 (C=O амида), 1700 (C=O лактама), Спектр ЯМР 1 Н, δ , м. д.: 1.36 (6H, c, 2CH₃); 2.78 (2H, c, 7-CH₂); 2.95–3.50 (8H, м, 4CH₂ морфолина); 3.63 (2H, c, 3-CH₂); 7.10–7.57 (4H, м, Ar). Масс-спектр, m/z (I, %): 354 [М $^{+}$] (52); 200 [М $^{+}$ –C(O)N(CH₂)₄CC(O)] (100); 86 [C(O)N(CH₂)₄] (86); 42 [CH₂C(O)] (78 %). Найдено, %: C 67.7; H 6.2; N 8.0. C₂₀H₂₂N₂O₄. Вычислено, %: C 67.8; H 6.3; N 7.9.

2,2-Диметил-6-(N-морфолинокарбонил)-1,2,3,4,5,6-гексагидронафто[1,2-h]- хинолизин-3,4-дион (2) получают аналогично из 3.90 г (10 ммоль) соответствую- щего морфолида ряда бензо[f]изохинолина [3]. Выход 70 %, т. пл. 114–116 °C. ИК спектр, v, см $^{-1}$: 1630 (С=О кетона), 1670 (С=О амида), 1690 (С=О лактама), Спектр ЯМР 1 Н, δ , м. д.: 1.32 (6H, c, 2CH $_{3}$); 3.0 (2H, c, 1-CH $_{2}$); 3.0–3.64 (8H, м, 4CH $_{2}$ морфолина); 3.70 (2H, c, 5-CH $_{2}$); 7.16–7.90 (6H, м, Ar). Масс-спектр, m/z (I, %): 404.5 [М $^{+}$] (43); 250 [М $^{+}$ — C(O)N(CH $_{2}$) $_{4}$ CC(O)] (100); 86 [C(O)N(CH $_{2}$) $_{4}$] (75); 42 [CH $_{2}$ C(O)] (70 %). Найдено, %: C 71.2; H 5.9; N 7.0. C_{24} H $_{24}$ N $_{2}$ O $_{4}$. Вычислено, %: C 71.3; H 6.0; N 6.9.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

- 1. Н. Н. Полыгалова, А. Г. Михайловский, *XГС*, 1108 (2006). [Chem. Heterocycl. Comp., **42**, 959 (2006)].
- 2. А. Г. Михайловский, В. С. Шкляев, Б. Б. Александров, *XTC*, 808 (1990). [*Chem. Heterocycl. Comp.*, **26**, 674 (1990)].
- 3. А. Г. Михайловский, Б. Я. Сыропятов, В. С. Шкляев, Ю. П. Тимофеева, А. В. Долженко, *Хим.-фарм.* журн., **32**, № 8, 21 (1998).

О. В. Сурикова, А. Г. Михайловский, М. И. Вахрин

Поступило 05.06.2008

Пермская государственная фармацевтическая академия Пермь 614990, Россия e-mail: perm@pfa.ru

XΓC. - 2008. - № 10. - C. 1586.