

## СИНТЕЗ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ ПОХІДНИХ ХІНАЗОЛІН-4(3Н)-ОНУ 1,2,2-ТРИМЕТИЛЦИКЛОПЕНТАНОВИМ ФРАГМЕНТОМ У ДРУГОМУ ПОЛОЖЕННІ

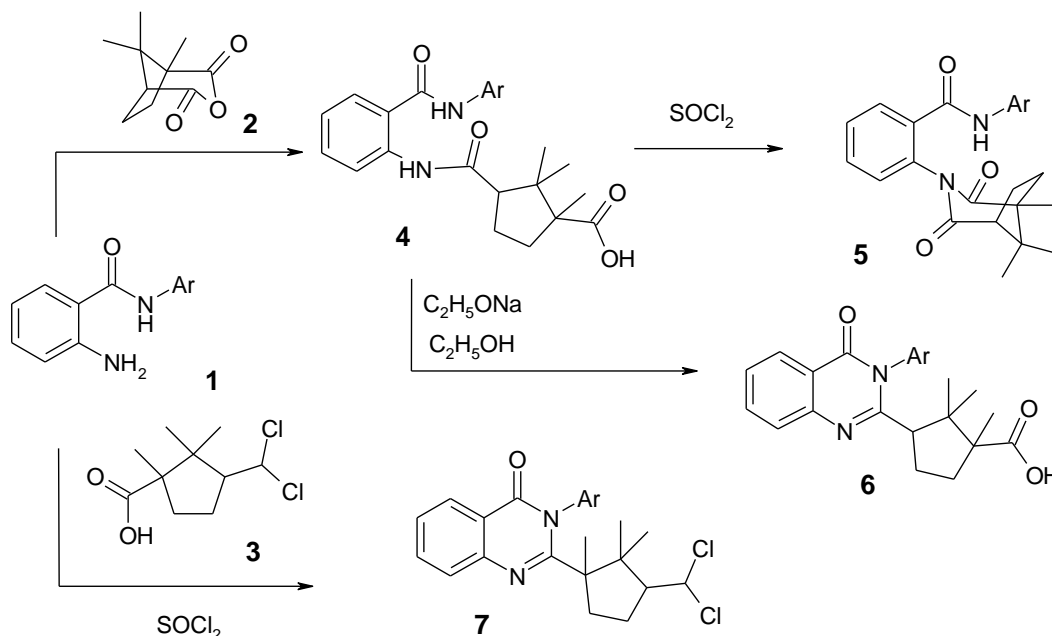
Цапко Є.О., Ситнік К.М.

*Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна  
evgentsapko@ukr.net*

У попередніх дослідженнях нами синтезовані похідні хіназолін-4(3Н)-ону, що містять у третьому положенні залишок 1,2,2-триметилциклопентан-1,3-дикарбонової кислоти. Серед зазначених сполук виділені речовини, що виявляють діуретичну, протисудомну та гіпоглікемічну активності. З метою розширення зазначеного ряду сполук та визначення закономірностей будова-дія нами синтезовані похідні хіназолін-4(3Н)-ону з 1,2,2-триметилциклопентановим фрагментом у другому положенні.

Синтез цільових сполук проводили на основі N-арилантраніламідів **1** (схема). При їх ацилюванні ангідридом 1,2,2-триметилциклопентан-1,3-дикарбонової кислоти **2** були виділені амідів **4**. При дегідратації сполук **4** тіоніл хлоридом гетероциклізації з утворенням хіназолін-4(3Н)-онового ядра не відбувається, а реакція перебігає з утворенням імідів 1,2,2-триметилциклопентан-1,3-дикарбонової кислоти **5**. 3-(3-Арил-хіназолін-4(3Н)-2-іл)-1,2,2-триметилциклопентанкарбонової кислоти **6** вдалося отримати обробкою амідів **4** натрій етаноліатом в середовищі етанолу з низькими виходами.

Схема



Для циклізації антраніламідного фрагменту вихідних сполук **1**, нами, також, було використано 3-дихлорметил-1,2,2-триметилциклопентанкарбонову кислоту **3**. При взаємодії сполук **1** і **3** у присутності водовіднімаючих реагентів утворюються 2-(1,2,2-триметил-3-дихлорметил-циклопентил)-3-арил-хіназолін-4(3Н)-они **7**. Дихлорметильна група хіназолін-4(3Н)-онів **7** має потенціал до перетворення на карбоксильну, що дасть можливість отримати кислоти, ізомерні кислотам **6**.