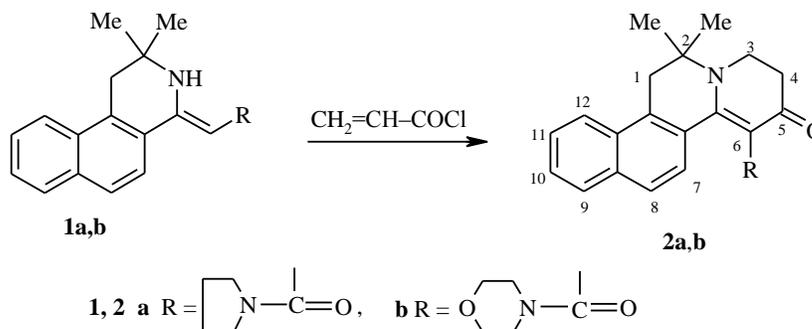


РЕАКЦИЯ ЕНАМИНОАМИДОВ РЯДА 1,2,3,4-ТЕТРАГИДРОБЕНЗО[*f*]ИЗОХИНОЛИНА

С АКРИЛОИЛХЛОРИДОМ

Ключевые слова: акрилоилхлорид, 6-аминокарбонил-2,2-диметил-1,2,3,4-тетрагидро-нафто[1,2-*h*]хинолизион-5, енаминоамиды ряда 1,2,3,4-тетрагидробензо[*f*]изохинолина.

Реакции акрилоилхлорида с циклическими енаминами до настоящего времени малоизвестны. Продолжая наши исследования в области реакционной способности енаминов, производных 1,2,3,4-тетрагидроизохинолина [1], мы обнаружили, что енаминоамиды **1a,b** [2] при кипячении в бензоле с акрилоилхлоридом в присутствии триэтиламина образуют тетра-циклические кетоны **2a,b**.



Кетоенамиды **2a,b** представляют собой желтые кристаллические вещества, образующие гигроскопичные водорастворимые гидрохлориды, что подтверждает основной характер атома азота, т. е. факт ацилирования по атому углерода, а не по атому азота изохинолинового цикла.

Соединения **2a,b** и им подобные можно рассматривать в качестве аналогов азахризена [3], являющихся потенциальными синтонами и лекарственными веществами.

Спектры ЯМР ^1H снимали на приборе Varian Mercury-300 (300 МГц) в CDCl_3 , внут-ренний стандарт ГМДС (δ 0.05 м. д.), ИК спектры – на Specord M-80 в вазелиновом масле, масс-спектры – на МАТ-311 (70 эВ, ЭУ).

2,2-Диметил-6-(N-пирролидинокарбонил)-1,2,3,4-тетрагидронафто[1,2-*h*]хинолизи-он-5 (2a). К раствору 3.20 г (10 ммоль) соединения **1a** и 1.5 мл (11 ммоль) триэтиламина в 100 мл бензола добавляют 0.8 мл (10 ммоль) акрилоилхлорида. Выпавший осадок гидрохлорида триэтиламина отфильтровывают. Реакционную смесь кипятят еще 2 ч, при этом раствор слегка мутнеет. После охлаждения до 20 °С смесь разбавляют 150 мл гексана, выпавший осадок отфильтровывают, тщательно промывают водой, сушат и перекристал-лизуют из циклогексана. Выход 61%. т. пл. 208–210 °С. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1630 и 1675 (C=O). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 1.40 (6H, с, 2CH₃); 1.15–1.80 (4H, м, 2CH₂-C); 2.4–3.8 (м, 4H, 2CH₂-N и 4H, CH₂CH₂CO); 3.35 (2H, с, H-1); 7.15–8.07 (6H, м, Ar). Масс-спектр, m/z (*I*, %): 374.5 [M^+] (10); 304 [$\text{M}^+ - \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2)_4$] (25). Найдено, %: C 76.8; H 6.9; N 7.6. $\text{C}_{24}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_2$. Вычислено, %: C 77.0; H 7.0; N 7.5.

2,2-Диметил-6-(N-морфолинокарбонил)-1,2,3,4-тетрагидронафто[1,2-*h*]хинолизи-он-5 (2b) получают аналогично из 3.36 г (10 ммоль) соединения **1b**, выход 68%, т. пл. 120–122 °С. ИК спектр, ν , cm^{-1} : 1635 и 1675 (C=O). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д.: 1.35 (6H, с, 2CH₃); 2.75–3.80 (8H, м, 4CH₂ морфолина и 4H, CH₂CH₂CO); 3.30 (2H, с, H-1); 7.30–8.12 (6H, м, Ar). Масс-спектр, m/z (*I*, %): 390.5 [M^+] (8); 304 [$\text{M}^+ - \text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_2)_4\text{O}$] (27). Найдено, %: C 73.4; H 6.7; N 7.3. $\text{C}_{24}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_3$. Вычислено, %: C 73.4; H 6.9; N 7.1.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. A. G. Mikhailovskii, B. Ya. Syropyatov, A. V. Dolzhenko, V. S. Shklyayev, in *Nitrogen-containing Heterocycles and Alkaloids*, V. G. Kartsev, G. A. Tolstikov (Eds.), Iridium-Press, Moscow, 2001, vol. 1, p. 435, 2.
2. А. Г. Михайловский, Б. Я. Сыропятов, В. С. Шкляев, Ю. П. Тимофеева, А. В. Долженко, *Хим.-фарм. журн.*, № 8, 21 (1998).
3. M. J. Hearn, S. L. Swanson, *J. Heterocyclic Chem.*, **18**, 207 (1981).

Н. Н. Полыгалова, А. Г. Михайловский

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

Поступило 06.04.2006

