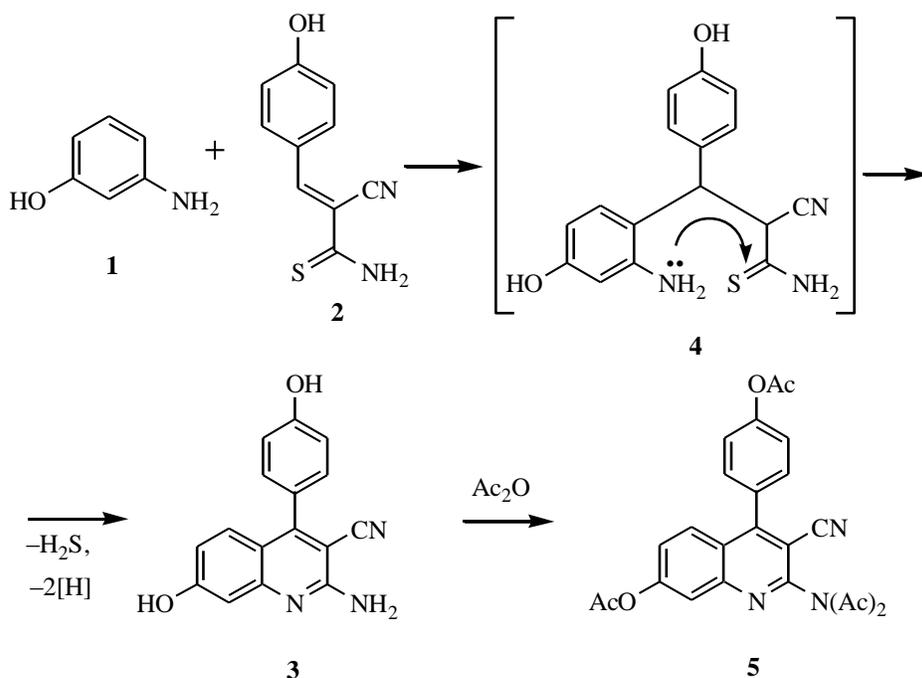


ЭФФЕКТИВНЫЙ ПУТЬ К ЗАМЕЩЕННОМУ 2-АМИНОХИНОЛИНУ

Ключевые слова: 1,3-аминофенол, 4-гидроксибензилмалонитрилоацетамид, замещенный 2-аминохинолин, ацилирование, реакция Михаэля.

1,3-Аминофенол присоединяется по Михаэлю к 4-гидроксибензилмалонитрилу с дальнейшей внутримолекулярной циклизацией в замещенный 2,7-диамино-4Н-бензо[*b*]пиран [1]. Мы обнаружили, что введение в реакцию с 1,3-аминофенолом **1** 4-гидроксибензилмалонитрилоацетамида (**2**) в этаноле в присутствии морфолина приводит к образованию 2-амино-7-гидрокси-4-(4-гидроксифенил)-3-цианохинолина (**3**). Таким образом, 1,3-аминофенол **1** первоначально присоединяется к активированному алкену **2** не по положению 6, что привело бы к соответствующему пирану, а по положению 4 с образованием аддукта Михаэля **4**. Последний под действием морфолина уже при комнатной температуре внутримолекулярно циклизуется в замещенный 2-аминохинолин **3**. Кипячение его в уксусном ангидриде позволяет получить соответствующее тетраацильное производное **5**, перспективное для поиска лекарственных препаратов [2].



Спектры ЯМР ^1H снимали на приборе Bruker DR-500 (500 МГц) в ДМСО- d_6 .

2-Амино-7-гидрокси-4-(4-гидроксифенил)-3-цианохинолин (3). Выход 76%, т. пл. 198–200 °С (из EtOH). ИК спектр (вазелиновое масло), ν , cm^{-1} : 3304, 3420, 3495 (NH_2 , OH); 2218 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 1673 (δ NH_2). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 11.32 и 10.11 (по 1H, оба уш. с, 2OH); 8.21 (2H, уш. с, NH_2); 7.34 (3H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$); 7.06 (1H, с, H-8); 6.98 (3H, м, $\text{H}_{\text{аром}}$). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 278 [$\text{M}+1$] $^+$ (27), 277 [M] $^+$ (100), 260 (12), 249 (25). Найдено, %: C 69.14; H 3.82; N 15.36. $\text{C}_{16}\text{H}_{11}\text{N}_3\text{O}_2$. Вычислено, %: C 69.31; H 4.00; N 15.15.

7-Ацетокси-2-диацетиламино-4-(4-ацетоксифенил)-3-цианохинолин (5). Выход 70%, т. пл. 168 °С (из AcOH). ИК спектр (вазелиновое масло), ν , cm^{-1} : 2216 ($\text{C}\equiv\text{N}$); 1694 ($\text{C}=\text{O}$). Спектр ЯМР ^1H , δ , м. д. (J , Гц): 7.95 (1H, с, H-8); 7.88 (1H, д, J = 9.30, H-6); 7.70 (2H, д, J = 7.74, H-3 и H-5 Ar); 7.68 (1H, д, J = 9.30, H-5); 7.48 (2H, д, J = 7.74, H-2 и H-6 Ar); 2.35 (12H, с, 4 CH_3). Масс-спектр, m/z ($I_{\text{отн}}$, %): 445 [M] $^+$ (6), 403 (29), 388 (25), 361 (32), 346 (41), 319 (40), 304 (42), 277 (43), 43 [Ac] $^+$ (100). Найдено, %: C 64.61; H 4.12; N 9.50. $\text{C}_{24}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_6$. Вычислено, %: C 64.72; H 4.30; N 9.43.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Г. В. Клокол, Л. Г. Шаранина, В. Н. Нестеров, В. Е. Шкловер, Ю. А. Шаранин, Ю. Т. Стручков, *ЖОрХ*, **23**, 412 (1987).
2. *Общая органическая химия*, под ред. Д. Бартона, У. Д. Оллиса, Химия, Москва, 1985, **8**, 196.

В. Д. Дяченко, А. Г. Кудрявцева

*Луганский государственный педагогический
университет им. Тараса Шевченко,
Луганск 91011, Украина
e-mail: dvd_lug@online.lg.ua*

Поступило в редакцию 08.09.2004

ХГС. – 2004. – № 11. – С. 1728
