

2-МЕТИЛ-4-АНИЛИНО-1,2,3,4-ТЕТРАГИДРОХИНОЛИНЫ В РЕАКЦИЯХ АЦИЛИРОВАНИЯ И КАРБАМОИЛИРОВАНИЯ

И. Шукер, Л. Ф. Пономарева, С. М. Медведева, Х. С. Шихалиев, А. И. Сливкин

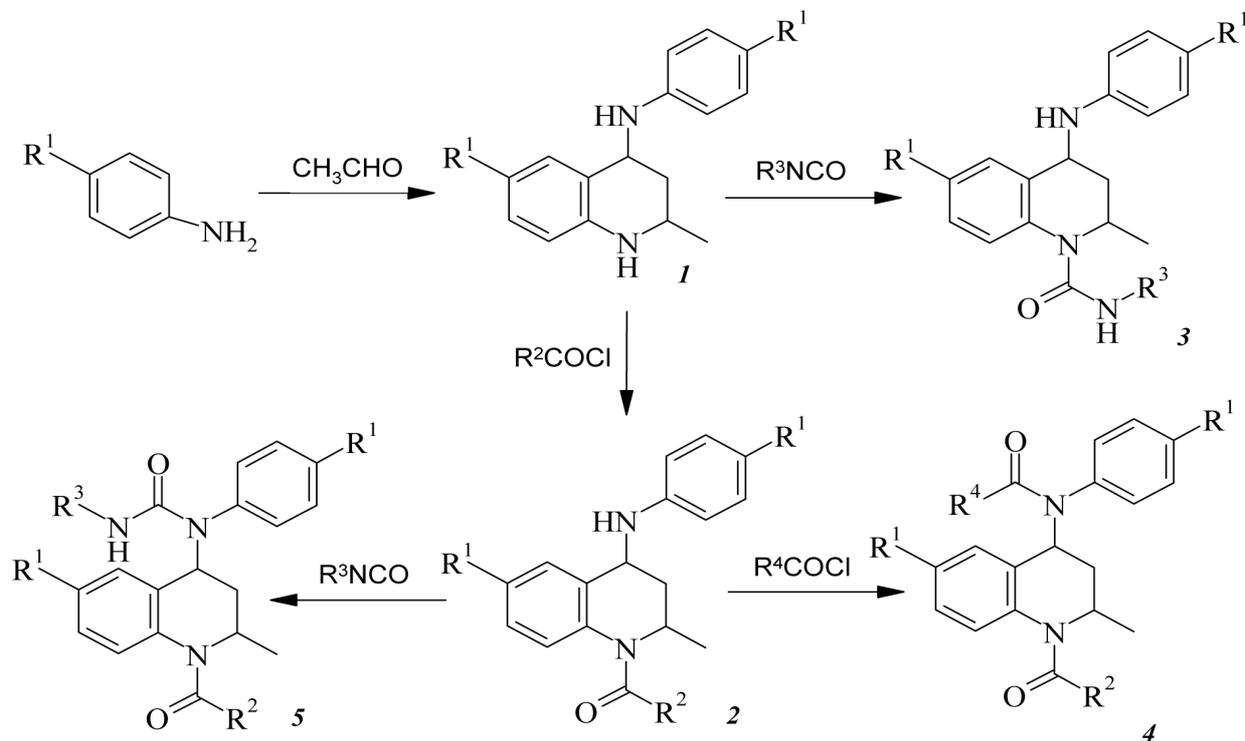
Воронежский государственный университет

Установлено, что взаимодействие 4-анилино-2-метилтетрагидрохинолинов с ацилхлоридами и изоцианатами при низких температурах приводит к селективному ацилированию и карбамоилированию по эндо-атому азота с образованием монопроизводных. Экзо-атом азота 4-анилино-2-метилтетрагидрохинолинов подвергается электрофильной атаке только при температурах выше 100 °С.

Известно, что фрагмент тетрагидрохинолина входит в состав соединений являющихся антиоксидантами, ингибиторами коррозии металлов, а также проявляют широкий ряд биологической активности [1]. С целью получения новых потенциально биологически активных соединений нами изучена реакционная способность 2-метил-4-анилино-1,2,3,4,-тетрагидрохинолинов, имеющих в своей структуре две реакционно способные аминогруппы: эндо- и экзоциклическую, в реакциях ацилирования и карбамоилирования.

Взаимодействие исходных 4-анилино-2-метилтетрагидрохинолинов **1**, полученных по известной методике [2] конденсацией замещенных анилинов с ацетальдегидом при 0 °С в среде этанола, с ацилхлоридами и изоцианатами осуществлялось в различных условиях.

Оказалось, что в отсутствии основных акцепторов хлороводорода ацилирование протекает медленно и сопровождается значительным осмолением реакционной массы. При проведении реакции в абсолютном тетрагидрофуране в присутс-



1 — R¹ = H (a), Me (b); **2** — R¹ = H, R² = CH₃ (a), R¹ = CH₃, R² = CH₃ (b), R¹ = H, R² = C₂H₅ (c) R¹ = CH₃, R² = C₂H₅ (d); **3** — R¹ = H, R³ = C₂H₅ (a), R¹ = CH₃, R³ = C₂H₅ (b), R¹ = H, R³ = C₆H₅ (c) R¹ = CH₃, R³ = C₆H₅ (d); **4** — R¹ = H, R² = CH₃, R⁴ = CH₃ (a), R¹ = H, R² = CH₃, R⁴ = C₂H₅ (b); **5** — R¹ = H, R² = CH₃, R³ = C₂H₅ (a), R¹ = H, R² = CH₃, R³ = C₆H₅ (b)

твии пиридина, в качестве акцептора выделяющегося хлороводорода, при низких температурах и эквимольном соотношении реагентов ацилирование идет исключительно по эндо-атому азота. В результате с выходами 35—50% получены моноацилпроизводные **2**.

Селективное карбамоилирование удалось осуществить только при взаимодействии 4-анилино-2-метилтетрагидрохинолинов **1** с изоцианатами в тетрагидрофуране при низких температурах и соотношении реагент-субстрат 1:1. Взаимодействие также протекает по эндо-атому азота и приводит к образованию мочевины **3** с выходами 40—60%.

Установлено, что экзо-атом азота 4-анилино-2-метилтетрагидрохинолинов **1** подвергается электрофильной атаке только при температурах выше 100 °С при кипячении реагентов в диоксане или

толуоле. В результате при взаимодействии с ацилхлоридами получены диацилпроизводные **4** с выходами, достигающими до 70%. Взаимодействие моноацилпроизводных **3** с изоцианатами приводит к образованию с высокими выходами (65—85%) мочевины **5**.

Полученные соединения **2-5** представляют собой легкокристаллизующиеся бесцветные вещества с четкими температурами плавления. Структура соединений **2-5** подтверждается данными элементного анализа, ¹Н ЯМР спектроскопии и масс-спектрометрии.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. *Шмырева Ж. В.* 2,2,4-триметилгидрохинолины. Воронеж, изд-во Воронеж. ун-та, 1999 г., 127 с.
2. *Задукеев Л. П., Спицина Л. Я.* Журн. общей химии. 1961. С. 3067.