



МИНОБРАЗОВАНИЯ РОССИИ
ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ
ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ
«ВОРОНЕЖСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ УНИВЕРСИТЕТ»

Химический факультет
Кафедра органической химии

**Дигидрохинолин-8-карбогидразиды в реакциях линейной и
циклоконденсации с альдегидами**

Бакалавриат, направление 04.03.01 Химия

Обучающаяся: Чишко Т.Е.
Научный руководитель: к.х.н., доц. Медведева С.М.

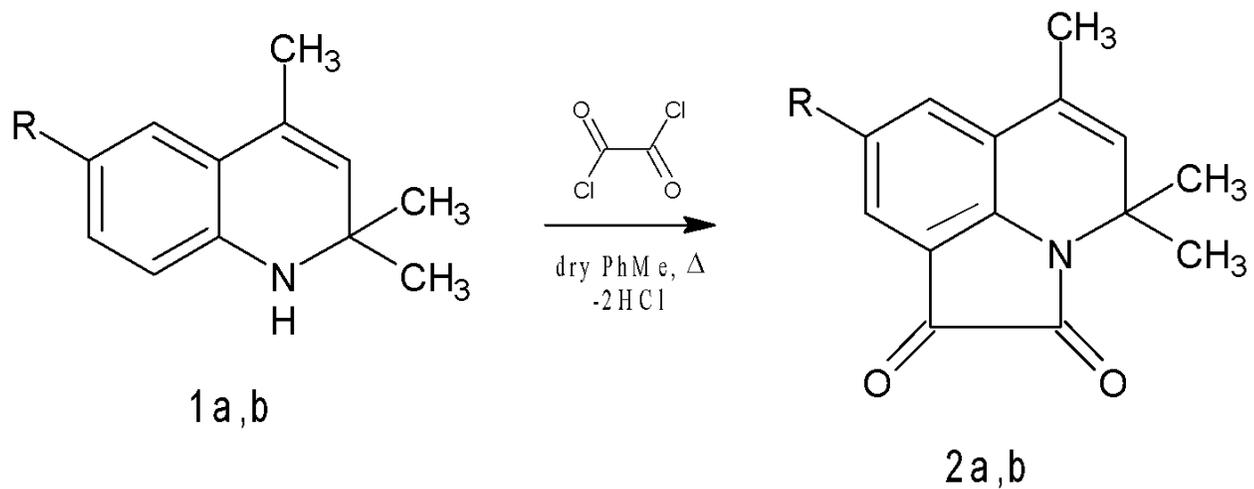


Цель работы: получение замещенных дигидрохинолин-8-карбогидразидов и синтез на их основе новых линейно связанных и аннелированных гетероциклических соединений ряда гидрохинолина.

Задачи:

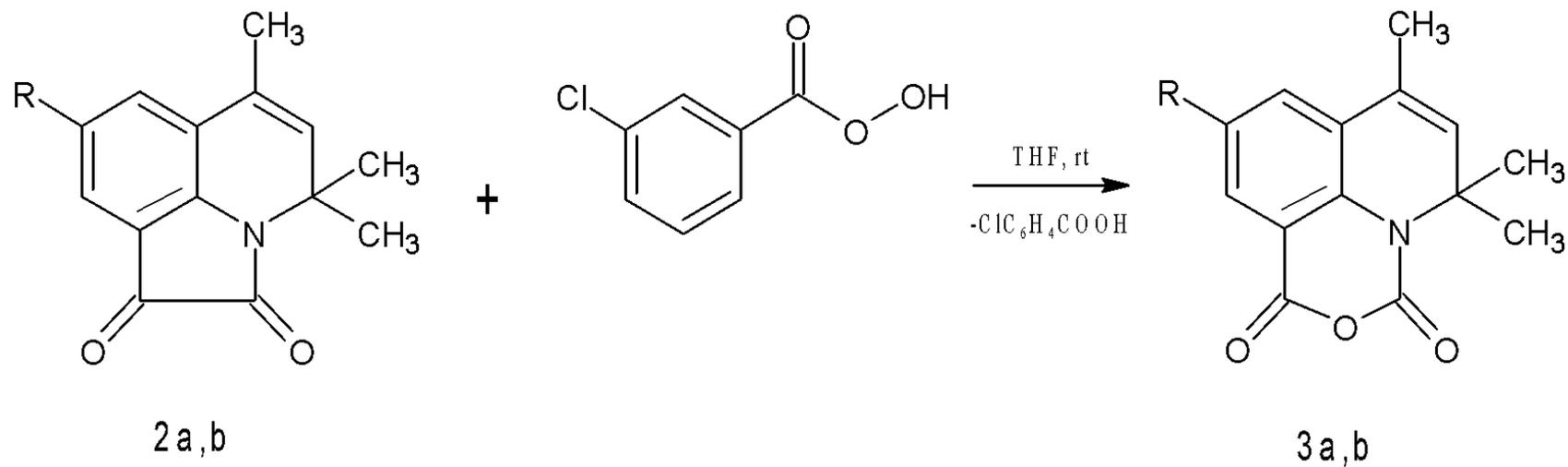
- подбор литературных данных по конденсации моноциклических гомологов гидрохинолин-8-карбогидразидов – гидразидов замещенных антраниловых кислот;
- получение исходных [1,3]оксазино[5,4,3-*i,j*]хинолин-1,3-дионов;
- проведение реакций [1,3]оксазино[5,4,3-*i,j*]хинолин-1,3-дионов с некоторыми гидразинами;
- осуществление реакций конденсации и циклоконденсации различных альдегидов с дигидрохинолин-8-карбогидразидами;
- доказательство структур и проведение виртуального биологического скрининга синтезированных соединений.

Синтез исходных соединений



1R = Me(a), EtO(b)

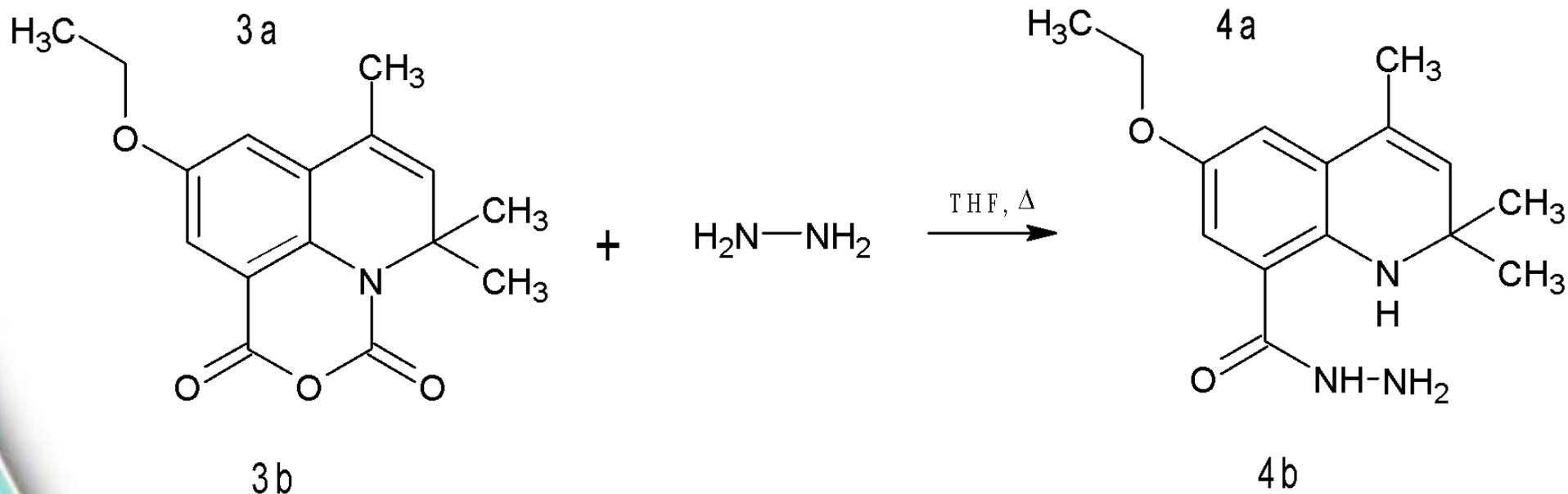
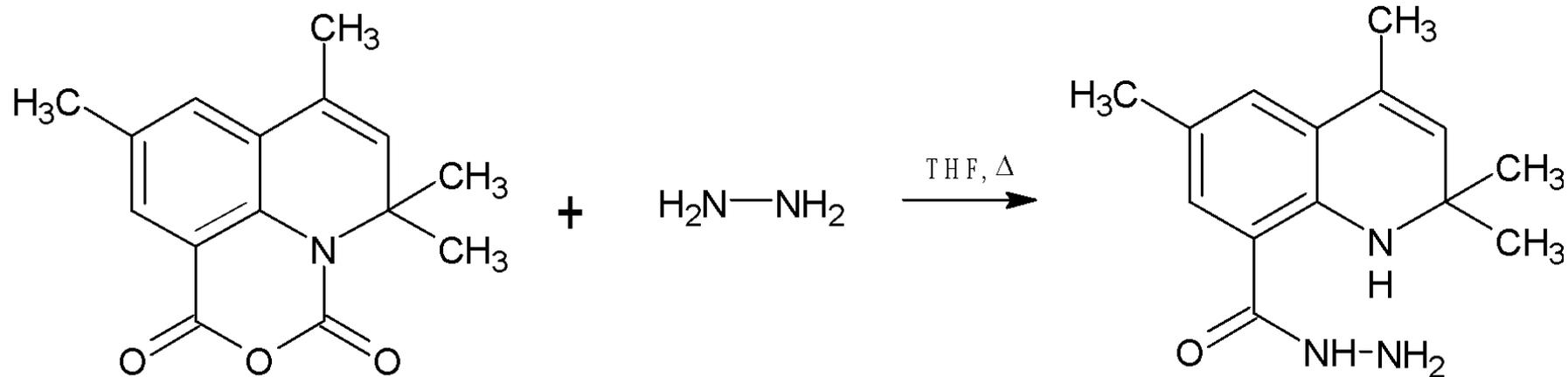
2,R = Me(a), EtO(b)



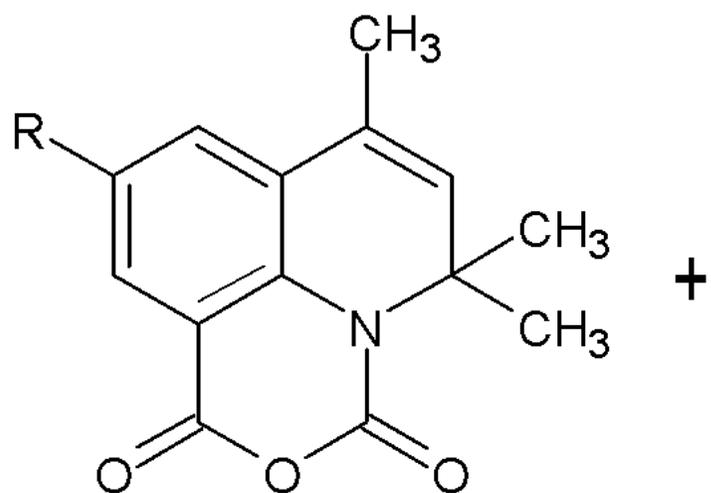
2R = Me(a), EtO(b)

3R = Me(a), EtO(b)

Взаимодействие [1,3]оксазино[5,4,3-*i,j*]хинолин-1,3-дионов с гидразинами



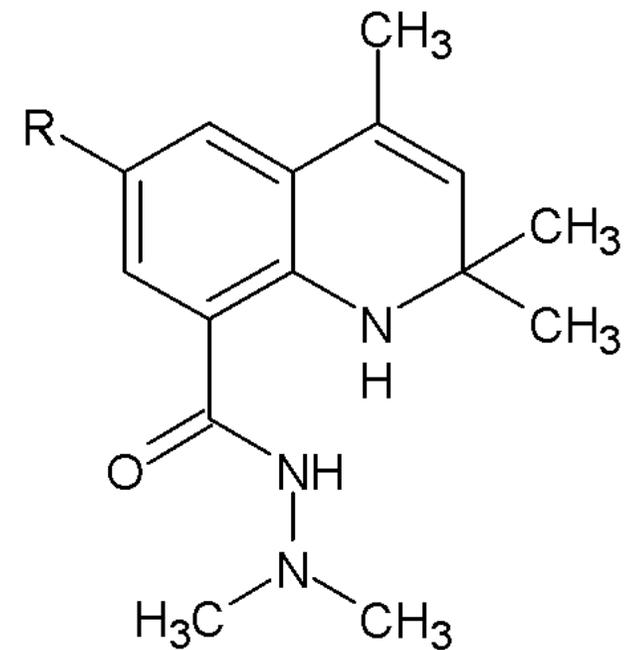
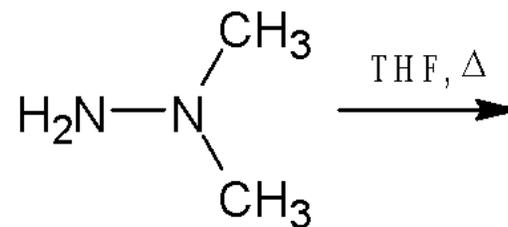
Взаимодействие [1,3]оксазино[5,4,3-*i,j*]хинолин-1,3-дионов с 1,1-диметилгидразином



3 a, b

3 R = Me (a), EtO (b)

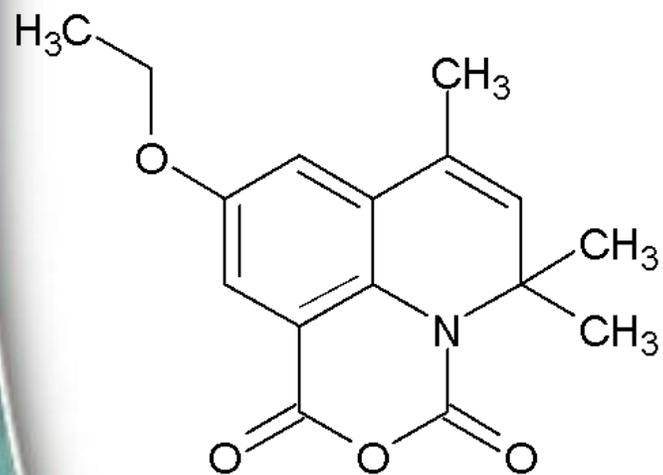
+



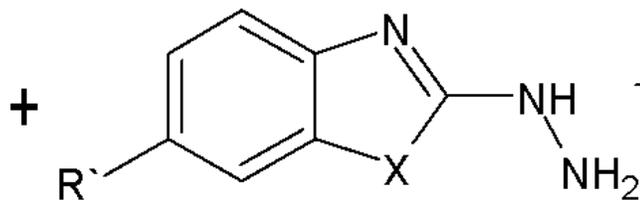
5 a, b

5 R = Me (a), EtO (b)

Взаимодействие [1,3]оксазино[5,4,3-*i,j*] хинолин-1,3-диона с монозамещенными гетероциклическими гидразинами



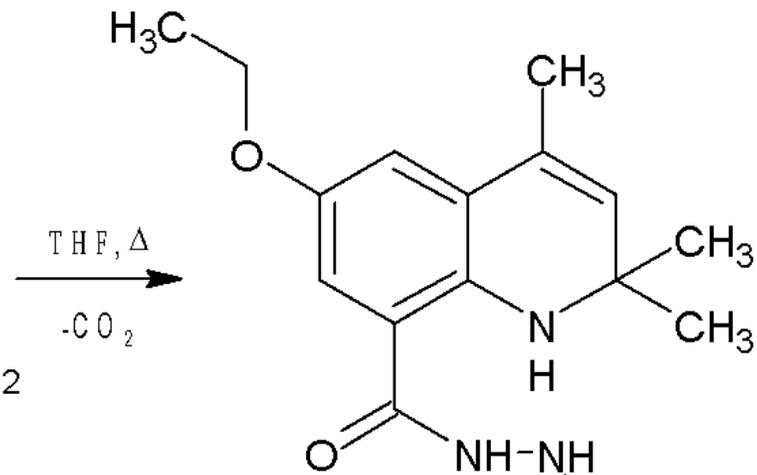
3b



6a,b

6a: R' = CH₃, X = NH

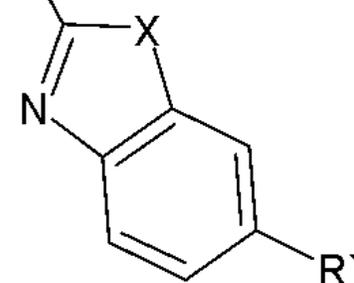
6b: R' = H, X = S



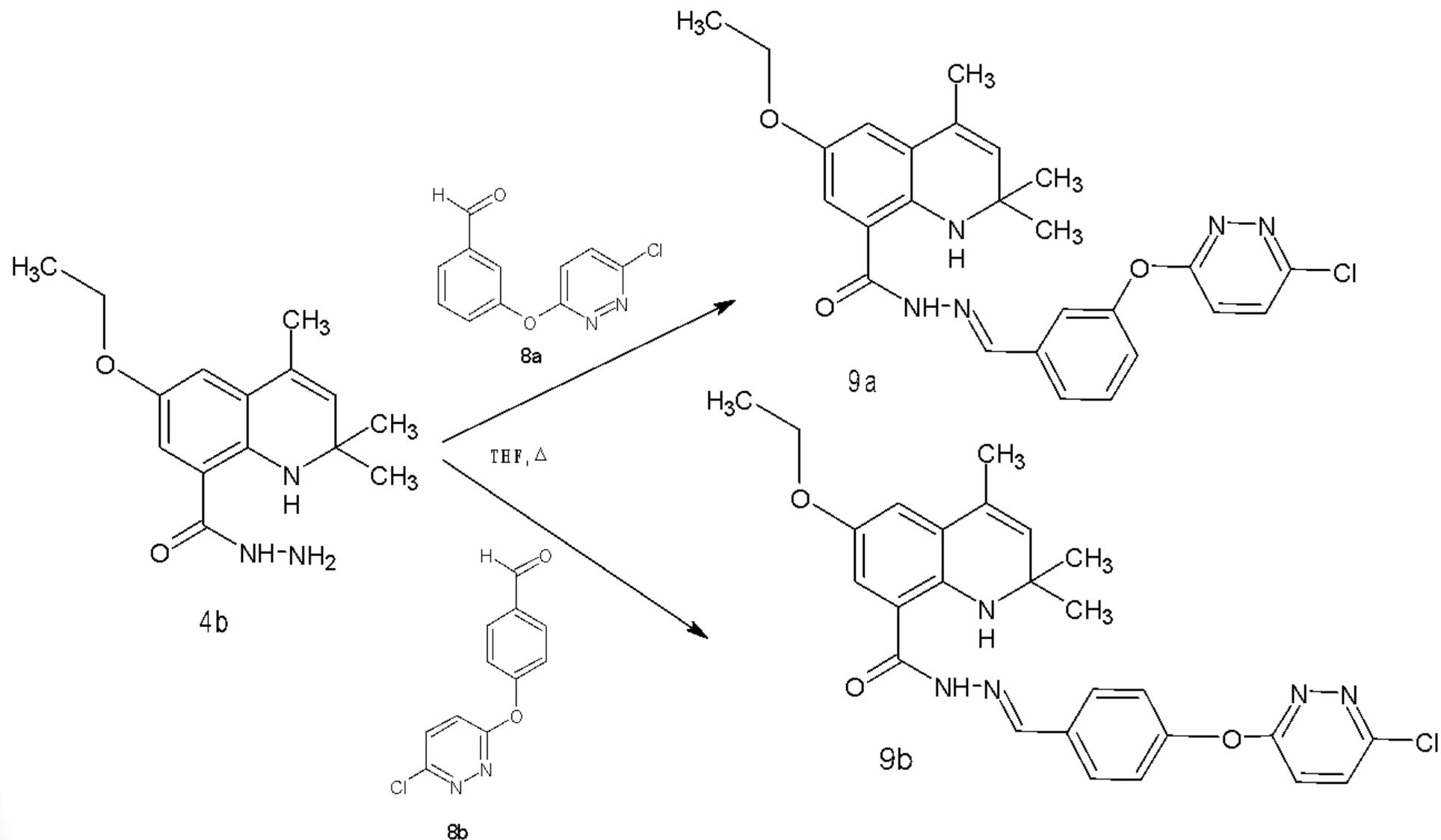
7a,b

7a: R' = CH₃, X = NH

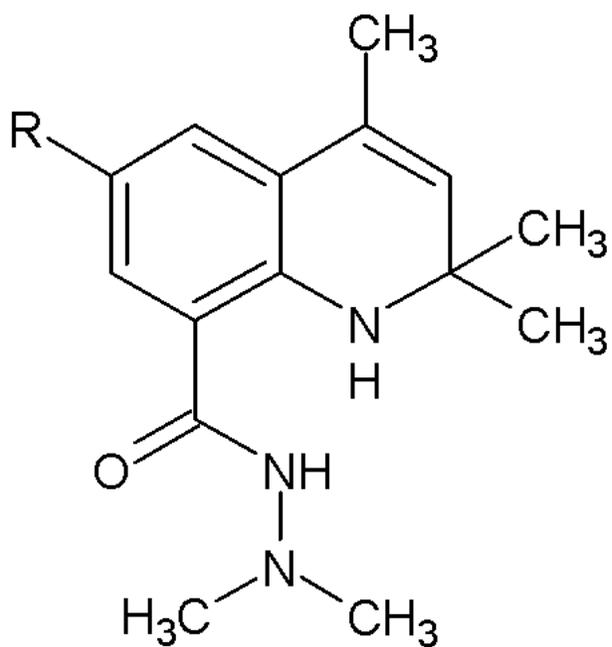
7b: R' = H, X = S



Взаимодействие 6-этоксипиридина-2,2,4-триметил-1,2-дигидрохинолин-8-карбогидразида 4b с ароматическими альдегидами

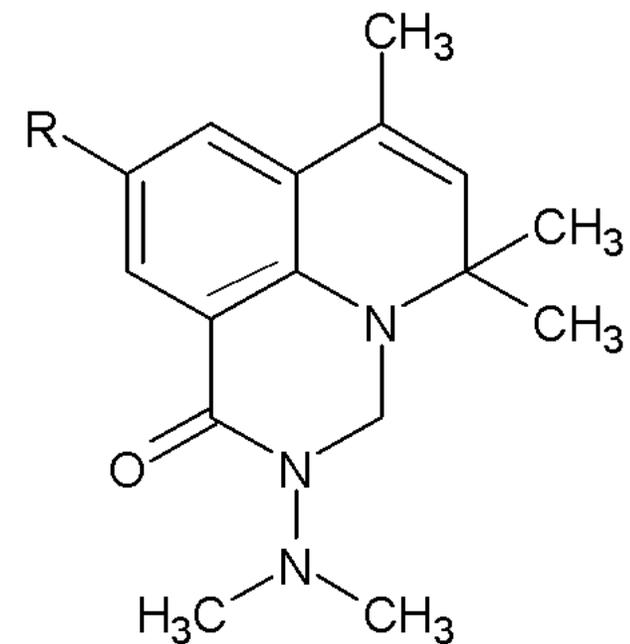
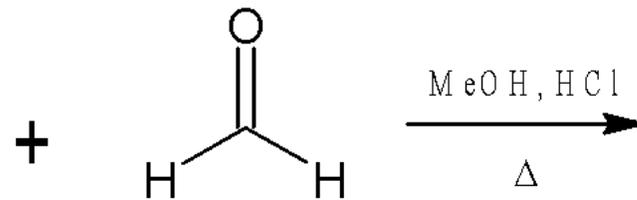


Взаимодействие 6-R-N',N',2,2,4,6-гексаметил-1,2-дигидрохинолин-8-карбогидразидов 5a,b с формальдегидом



5 a, b

5 R = Me (a), EtO (b)



10 a, b

10 R = Me (a), EtO (b)

Выводы

1. Синтезировано 5 ранее не описанных замещенных 2,2,4-триметил-1,2-дигидрохинолин-8-карбогидразидов.
2. Разработаны два подхода к синтезу гибридных соединений, в которых фрагмент гидрохинолина связан линкером с другим фармакофорным гетероциклом: первый основан на взаимодействии замещенного 1,3-оксазино[5,4,3-*i,j*]хинолин-1,3-диона с монозамещенными гетероциклическими гидразинами; второй заключается в конденсации замещенных дигидрохинолин-8-карбогидразидов с ароматическим альдегидом содержащим гетероциклический фрагмент.
3. Впервые синтезирована трициклическая химерная структура — тетрагидро-1H,5H-пиридо[3,2,1-*i,j*]хиназолин-1-он, в которой объединены фармакофорные фрагменты гидрохинолина и хиназолинона
4. Компьютерный прогноз биологической активности 9 новых синтезированных соединений, осуществленный посредством веб-ресурса PASS Online (<http://way2drug.com/PassOnline/>), показал, что полученные соединения могут являться ингибиторами и стимуляторами различных биохимических процессов, а также проявлять противоопухлевую, противовоспалительную и противовирусную активности.



Спасибо за внимание!