

НОВЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ АЛКАЛОИДА 2,3-ТЕТРАМЕТИЛЕН-3,4-ДИГИДРОХИНАЗОЛОНА-4 - ПОТЕНЦИАЛЬНЫЕ ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ

Б.Ж. Элмурадов, А.Ш.Абдуразаков, Х.М. Шахидоятов

Институт химии растительных веществ имени акад. С.Юнусова АН РУз, Ташкент, Узбекистан

Цель: изучение конденсации 6-ацетиламино-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4 с ароматическими альдегидами и поиск фармакологически активных веществ.

Методы: методы органической химии (конденсация) и физических методов исследования (масс-спектрометрия, ИК-, ^1H ЯМР-спектроскопия).

Результаты: конденсацией 6-ацетиламино-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4 с ароматическими альдегидами синтезированы 6-ацетиламино-10-арилиден-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4. 2,3-Тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4 – алкалоид, выделенный из растения *Mackin Ioya subulata* Philipson, его природные и синтетические аналоги проявляют высокую фармакологическую активность. В молекуле этих соединений имеется несколько реакционных центров (N-1, N-3, карбонильная группа при C-4, ароматическое и шестичленное кольца), которые позволяют провести реакции конденсации и замещения. Алкалоиды этого класса, их синтетические аналоги в настоящее время широко применяются в медицинской практике в качестве лекарственных (бронхорасширяющие, антихолинэстеразные, ингибиторы МАО, снотворные, анальгетики и др.) средств. Ранее нами была изучена конденсация 6-Н(бром, нитро)-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолонов-4 с ароматическими и гетероциклическими альдегидами и изучены бактерицидные свойства синтезированных веществ на различных грамположительных и грамотрицательных штаммах: *Staphylococcus* T50a, *Klebsiella pneumoniae* T3a, *Staphylococcus aureus* T48a, *Acinetobacter* sp. T16, *Enterococcus hormaechei* T2, *Escherichia coli* T60a, *Enterococcus hormaechei* T10, *Proteus rettgeri* T33a, *B. Cereus* T80, *Enterococcus faecalis* T23a, *Pseudomonas aureginosa* T31a, *Proteus agglomerans* T26, *Micrococcus luteus* T52a, *Pseudomonas aureginosa* T145, *Staphylococcus saprophyticus* T415, *Klebsiella oxitoca* T4a, *Acinetobacter haumanii* T15a. В данной работе мы исследовали конденсацию 6-ацетиламино-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4 с ароматическими и гетероциклическими (бензальдегид, п-гидрокси-, -диметиламино-, -нитро-, -3,4-диметокси-бензальдегиды, фурфурол) альдегидами. Реакции проведены в ледяной уксусной кислоте при кипячении реакционной смеси в течение 3-6 часов; при этом синтезированы соответствующие 6-ацетиламино-10-арилиден-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4.

Выводы: Синтезированы новые потенциальные фармакологически активные соединения-6-ацетиламино-10-арилиден-2,3-тетраметилен-3,4-дигидрохиназолон-4.