

ПОИСК НОВЫХ ПОТЕНЦИАЛЬНЫХ ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ НА ОСНОВЕ ТИОФЕНОВЫХ АНАЛОГОВ ТРИЦИКЛИЧЕСКИХ ХИНАЗОЛИНОВЫХ АЛКАЛОИДОВ

Х.А. Бозоров, Б.Ж. Элмуратов, Х.М. Шахидоятов

Институт химии растительных веществ, Ташкент, Узбекистан

Цель: исследование конденсации 5,6-диметил-2,3-триметилентиено[2,3-с!]-пиримидин-4-она с ароматическими альдегидами и поиск фармакологически активных веществ.

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

Результаты: конденсацией 5,6-диметил-2,3-триметилентиено [2,3-d] - пиримидин-4-она с ароматическими альдегидами синтезированы а-арилиден производные их. Производные трициклических хиназолиновых алкалоидов нашли широкое применение в медицинской практике. Среди них найдено достаточное количество препаратов с бронхорасширяющим, антихолинэстеразными свойствами, ингибиторы МАО, а также средства для

центральной нервной системы, желудочно-кишечного тракта, анальгетики и т.д. Например, дезоксипеганин гидрохлорид вошел в медицинскую практику и применяется в качестве антихолинэстеразного средства. Ранее была изучена химическая трансформация этих алкалоидов и их производных. Интересно было изучить химические превращения тиюфенового аналога трициклических хиназолиновых алкалоидов - 5,6-диметил-2,3-триметилентиено[2,3-с!]-пиримидин-4-она. Для осуществления поставленной цели мы синтезировали этиловый эфир 2-амино-4,5-диметилтиофен-3-карбоновой кислоты циклизацией метилэтилкетона с этиловым эфиром циануксусной кислоты в присутствии диэтиламина (или морфолина) и элементарной серы. Конденсация полученного эфира с у-бутиролактоном в присутствии хлорокиси фосфора приводит к 5,6-диметил-2,3-триметилентиено[2,3-с!]-пиримидин-4-ону. Для поиска потенциальных фармакологически активных соединений в данной работе мы изучили взаимодействие 5,6-диметил-2,3-триметилентиено [2,3-с1]-пиримидин-4-она с различными ароматическими альдегидами (бензальдегид, 3,4-диметокси-, п-гидрокси-, -диметиламино-, -нитробензальдегиды, фурфурол). Реакции проведены при нагревании смеси эквимольных количеств реагентов в этиловом спирте в присутствии гидроксида натрия и получены соответствующие а-арилиден-5,6-диметил-2,3-триметилентиено [2,3-с1]-пиримидин-4-оны с хорошими выходами.

Выводы: Впервые синтезированы новые потенциальные фармакологически активные α -арилиден-5,6-диметил-2,3-триметилен-тиено[2,3-с!]-пиримидин-4-оны. Структура синтезированных соединений доказана современными физико-химическими методами. Биологическая активность полученных веществ изучается.