

каталитического действия наноразмерных оксидов на реакцию Ганча. // Кинетика и катализ. 2010. № 4. С. 590–596.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФИ (грант № 10-03-90026-Бел_а), а также УрО РАН (проекты № 09-И-3-2004, 09-П-23-2001, 09-П-3-2001).

3-АМИНО-2-МЕТИЛ-6-ФТОР-7-ЦИКЛОАЛКИЛИМИНО-3Н-ХИНАЗОЛИН-4-ОНЫ – ПОТЕНЦИАЛЬНЫЕ ИНГИБИТОРЫ ДНК-ГИРАЗЫ

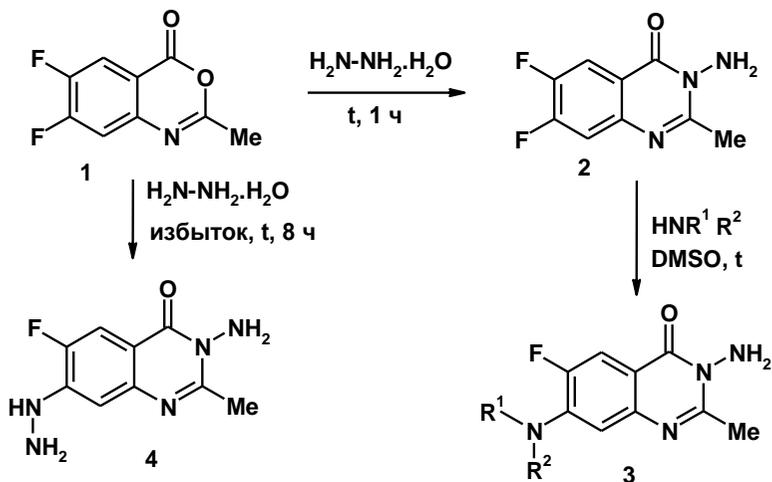
Малых Н.А.⁽¹⁾, Носова Э.В.⁽¹⁾, Липунова Г.Н.⁽²⁾, Чарушин В.Н.⁽²⁾

⁽¹⁾Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

⁽²⁾Институт органического синтеза РАН
620041, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

3-Амино-2-метил-6-фтор-7-циклоалкилиминохиназолин-2,4-дионы зарекомендовали себя в качестве высокоэффективных ингибиторов ДНК-гиразы [1]. Нами разработан удобный способ получения их аналогов **3** на основе дифторбензоксазина**1** [2].

Замещение атома фтора в 3-амино-2-метил-6,7-дифтор-3Н-хиназолин-4-оне **2** на остатки циклоалкилиминов протекает при кипячении в ДМСО с высокими выходами. Ранее было исследовано замещение F(7) на гидразиногруппу лишь в 6,7,8-трифторпроизводных 3-аминохиназолин-4-она. В данной работе определены оптимальные условия образования гидразинопроизводного**4**, что открывает новые возможности синтеза биологически активных соединений ряда фторсодержащих хиназолинонов.



3: NR¹R² = морфолин-4-ил (**а**), 3-метилпиперидин-1-ил (**б**), 4-метилпиперазин-1-ил (**в**), 4-этоксикарбонилпиперазин-1-ил (**г**).

Строение новых фторсодержащих хиназолинонов **3**, **4** подтверждено данными ЯМР ¹H, ¹⁹F и масс-спектров. Значения ³J(H(5), F(6)) и ⁴J(H(8), F(6)) составляют 12.8-13.1 и 7.9-8.1 соответственно. Получены данные рентгеноструктурного анализа для соединения **3б**.

1. Hutchings K.M. et al. Synthesis and antibacterial activity of the C-7 side chain of 3-aminoquinazolin-2(1H)-ones // *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2008. V. 18. № 18. p. 5087-5090.

2. Лаева А.А. и др. Синтез фторсодержащих хиназолин-4-онов на основе 1,3-бензоксазин-4-онов // *Журн. Органич. химии.* 2009. Т. 45. № 6. с. 925-932.

Работа выполнена при финансовой поддержке гранта Министерства образования и науки РФ 3.1941.2011.