

**RĪGAS TEHNISKĀ UNIVERSITĀTE**  
**Fr. CANDERA STUDENTU ZINĀTNISKĀ UN TEHNISKĀ**  
**BIEDRĪBA**

**54. RTU STUDENTU ZINĀTNISKĀS**  
**UN TEHNISKĀS**  
**KONFERENCES MATERIĀLI**

2013. gada aprīlī

**I**

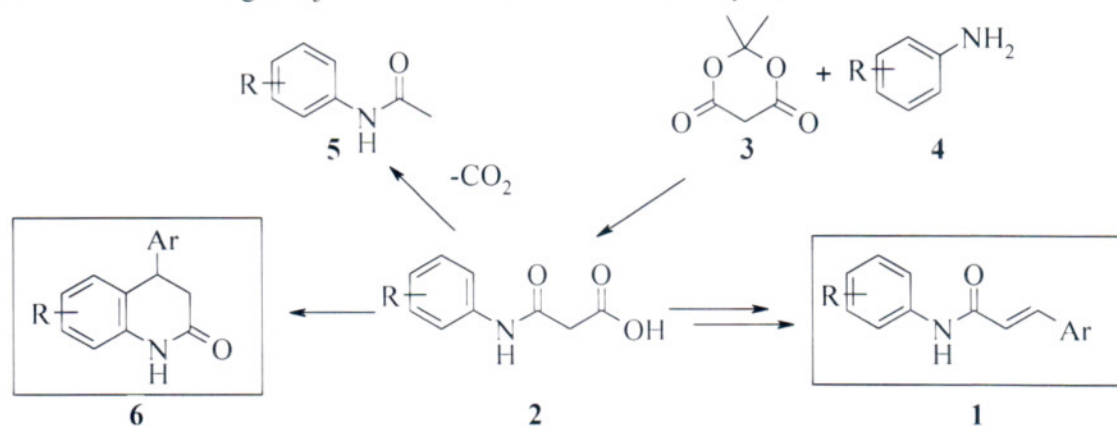
**ELEKTROZINĪBAS**  
**DATORZINĪBAS**  
**TELEKOMUNIKĀCIJAS**  
**MATERIĀLZINĀTNE**  
**TEKSTILMATERIĀLU TEHNOLOĢIJA UN DIZAINS**  
**MAŠĪNZINĪBAS**  
**BŪVNIECĪBA**  
**ARHITEKTŪRA**

RTU Izdevniecība

RĪGA – 2013

## KANĒĻSKĀBES ANILĪDU SINTĒZE UN CIKLIZĀCIJA

Kanēļskābes anilīdiem **1** ir konstatēta plaša spektra bioloģiskā aktivitāte: antioksidantu, antigenotoksiska, pretiekaisuma un pretniezes iedarbība. Šie savienojumi uzrādījuši arī pretvēža īpašības. 3,4-Dihidro-1*H*-hinolīn-2-ona fragmentu saturošie savienojumi tiek izmantoti medicīniskajā praksē (piemēram, *Cilostazol*, *Carteolol*, *Aripiprazole*) un ir pētīti kā potenciāli atipiskie antipsihotiskie, antiproliferatīvie un pretkrampju līdzekļi, p38 MAP kināzes un asins koagulācijas faktora Xa inhibitori un antidepresanti.



Savienojumus **1** būtu ērti iegūt no malonskābes monoanilīdiem **2** un aromātiskajiem aldehīdiem Knēvenageļa kondensācijas reakcijā: līdz šim minētā metode galvenokārt izmantota antranilskābes atvasinājumu – avenantramīdu – iegūšanai. Malonskābes monoamīdus **2** ieguvām, šķeļot meldrumskābi (**3**) ar atbilstošiem anilīniem **4**. Diemžēl nereti malonskābes monoanilīdi **2** reakcijas apstākļos viegli dekarboksilējās, veidojot attiecīgos acetanilīdus **5**. Lai samazinātu anilīdu **2** nevēlamo dekarboksilēšanos, veicām reakcijas apstākļu optimizāciju un noskaidrojām, ka elektrondonorus aizvietotājus saturošu anilīnu **4** gadījumā reakciju nepieciešams realizēt ūdenī tā viršanas temperatūrā. Šādos apstākļos malonskābes monoanilīdus **2** iespējams iegūt ar labiem iznākumiem, salīdzinoši īsā laikā. Šajos reakcijas apstākļos produktu **2** dekarboksilēšanās bija niecīga.

Kanēļskābes anilīdus **1** mēģinājām sintetēt pēc literatūrā aprakstītas metodikas – veicot savienojumu **2** reakcijas ar aromātiskajiem aldehīdiem piridīnā vai toluolā piperidīna vai  $\beta$ -alanīna klātbūtnē šķīdinātāja viršanas temperatūrā. Tā kā šādos apstākļos reakcijas maisījums saturēja tikai nelielu daudzumu produkta **1**, bet ļoti daudz acetanilīdu **5**, mēģinājām optimizēt sintēzes apstākļus. Noskaidrojām, ka, veicot reakciju etiķskābē 75°C temperatūrā, izejvielu **2** dekarboksilēšanās norit minimāli un veidojas vajadzīgie kondensācijas produkti, kurus tālāk dekarboksilējot var iegūt nepieciešamos kanēļskābes anilīdus **1**.

Mēģinot veikt savienojumu **2** kondensāciju ar aromātiskajiem aldehīdiem trifluoretiķskābē, ieguvām negaidītus reakcijas produktus – līdz ar kondensāciju noritēja arī izveidojušos kanēļskābes anilīdu karboksilatvasinājumu iekšmolekulāra ciklizācija un dekarboksilēšanās, veidojot 4-aryl-3,4-dihidro-1*H*-hinolīn-2-onus **6**. Iegūtie reakcijas produkti saturēja ~90% 3,4-dihidro-1*H*-hinolīn-2-onu **6**, bet pēc izdalīšanas savienojumu **6** iznākums vidēji bija 60%.

Autori izsaka pateicību AS „Olainfarm” par stipendiju A. Stikutei.