УДК 574.833 + 541.634

СИНТЕЗ И СТЕРЕОИЗОМЕРИЯ 1-[2-(3′,4′-ДИМЕТОКСИФЕНИЛ)ЭТИЛ]-2-ФЕНИЛ-ДЕКАГИДРОХИНОЛИН-4-ОНА

Жилкибаев О.Т.

Казахский национальный университет им. аль-Фараби, Алматы, e-mail: zhilkibaevoral@mail.ru

Осуществлен синтез и изучена стереоизомерия 1-[2-(3’,4’-диметоксифенил)этил]-2-фенилдекагидрохинолин-4-она. Выделены индивидуальные стереоизомеры и установлены их пространственные структуры: гетероциклизация диенона с гомовератриламином, в отличие от аммиака, приводит к образованию двух стереоизомеров с резким преобладанием аминокетона с транс-сочленением циклов. Выделенный в незначительном количестве второй изомер является представителем цис-ряда. У обоих стереоизомеров фенильная группа при С2 ориентирована экваториально.

Ключевые слова: декагидрохинолины, синтез, стереоизомерия

SYNTHESIS AND STEREOCHEMISTRY OF 1-[2-(3′,4′- DIMETHOXYPHENYL)ETHYL]-2-DECAHYDROQUINOLIN-4-ONES

Zhilkibayev O.T.

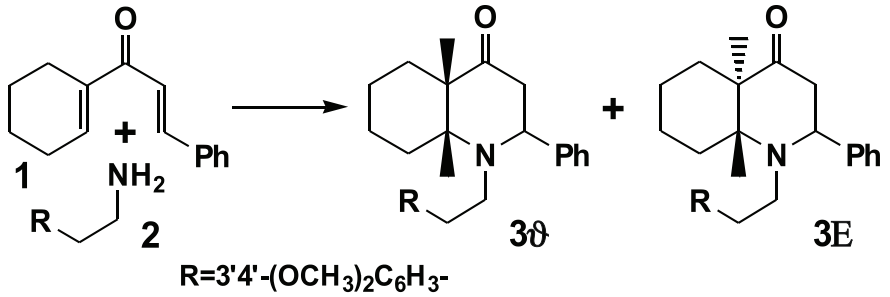
al-Farabi Kazakh National university, Almaty, e-mail: zhilkibaevoral@mail.ru

Synthesis and stereochemistry of 1-[2-(3’,4’-dimethoxyphenyl)ethyl]-2-phenyldecahydroquinolin-4-one have been carried out and studied. Individual stereoisomers have been isolated and their spatial structures have been established: heterocyclization of dienone with homoveratrylamine, in contrast to ammonia, leads to the formation of two stereoisomers with sharp predominance of aminoketone with trans-coupling of cycles. The second isomer, isolated in a small quantity, is a representative of a cis-row. The both stereoisomers possess an equatorially-oriented phenyl group at C3.

Keywords: decahydroquinolines, synthesis, stereoisomers

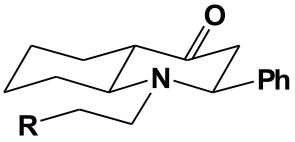
Литературные данные по биологической активности декагидрохинолиновых алкалоидов, а также накопленный к настоящему времени опыт по их синтезу открывают перспективы для создания новых эффективных лекарственных препаратов. Сочетание в одной молекуле декагидрохинолинового каркаса и диметоксифенилэтильной группы в синтезированных соединениях делает их близкими структурными аналогами природных алкалоидов.

Подобный подход использовали при получении 1-[2-(3′,4′-диметоксифенил) этил]-2-фенилдекагидрохинолин-4-она (**3**). Синтез данного аминокетона осуществляли гетероциклизацией стирил-1-циклогексенилкетона(**1**)с 2-(3′,4′-диметоксифенил)этиламином (гомовератриламином – близким аналогом природного алкалоида мессина) (**2**) в абсолютном этаноле. В результате реакции с 67%-м выходом образуется смесь двух стереоизомеров (**3 γ, β**), со значительным преобладанием изомера **3 γ**.

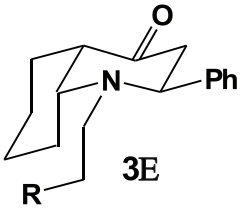


Полученная смесь пространственных изомеров **3 γ, β** разделена на индивидуальные формы дробной кристаллизацией из гексана. В итоге изолировано 74,3% (от общего количества смеси) изомера **3 γ** и лишь 2% – **3 β**. Строение индивидуальных сте-

реоизомеров **3 γ, β** установлено с помощью ИК-, ЯМР ^{1}H спектроскопии и масс-спектрометрии. Им приписаны следующие конфигурации:



3ϑ



3E

Гетероциклизация диенона **1** с гомовератриламином (**2**), в отличие от аммиака [15, 16], приводит к образованию двух стереоизомеров **3 γ** и **3 β** с резким преобладанием изомера **3 γ** с экваториальной ориентацией фенила при C^3 и *транс*-сочленением циклов. Выделенный в незначительном количестве второй изомер **3 β** является представителем *цис*-ряда.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Жилкибаев О.Т., Пралиев К.Д., Рожнов В.Б., Соколов Д.В. Стереохимия азотистых гетероциклов. VI. Стереоизомерия 2-фенилдекагидрохинолона-4 // Изв. АН КазССР. Сер. хим. – 1984. – № 2. – С. 81–86.