Synthesis of some quinazoline derivatives of expected biological activity

MOHAMED MOHAMDY AHMED ABD EL-WAHAB

المركبات الغير متجانسة الحلقة ذات المجموعات الوظيفية العديدة لها أهمية بيولوجية وخواصها الكيميائية استحقت اهتماماً في الماضي لذلك يهدف هذا العمل إلى تخليق بعض مشتقات البنزوكزازينون المحتوية على المفردات الكبيرة والتي لها ترابط قوي عند الوضع 2. ويمكن الحصول على مشتقات البنزوكزازينون (1) عن طريق تفاعل حمض الانثرانيليك مع داي بنزوثيوفينيل أكسيد- 4-أكسو- بيوترويل كلوريد. خلال هذا البحث تم دراسة تفاعل المركب (1) مع النيوكليوفيلات النيتروجينية مثل: الهيدرازين هيدرات، الهيدروكسيل أمين هيدروكلوريد، البنزويل هيدرازين، الببريدين، أورثوفنيلين داي أمين، صوديوم أزيد والفورماميد لكي يعطي مركبات مفتوحة الحلقة والتي تتحلق وفقاً لظروف التفاعل وطبيعة النيوكليوفيل. عندما يتفاعل الأمينوكينازولينون (2) مع الكلوروأسيتيل كلوريد ومع أنهيدريد حمض الأسيتيك فإنه يعطي 2-كلورو-نيتروجين-2-كلورو كينازولينيل أسيتاميد (3) ونيتروجين-أسيتيل-نيتروجين-كينازولينيل أسيتاميد (4) على الترتيب.3-هيدروكسي كينازولينون (5) يتفاعل مع إيثيل كلورو أسيتات وأسيتيل كلوريد ليعطي كينازولينيلوكسي-أستيك أسيد إيثيل أستر (6) وكينازولينيل أستر (7). تتضمن هذا الدراسة أيضاً تفاعل البنزووكزازينون (1) مع النيوكليوفيلات الكربونية مثل: إيثيل أسيتو أسيتات في البيريدين ليعطي مشتق فينيل بروبيونيك أسيد إيثيل أستر (13). عندما يتفاعل مشتق الكينازولينون (16) مع الإلكتروفيلات الكروبونية مثل: كلورواسيتوفينون، كلوريد البنزويل وإيثيل كلوروأسيتات في وجود كربونات البوتاسيوم كعامل مساعد وفى الاسيتون فانه يعطى مشتقات الكينازولين(17)، (19) ومشتق الكينازولينون (18). يتفاعل مشتق الكينازولينون (16) مع مخلوط من خامس كلوريد الفوسفور وأوكسي كلوريد الفوسفور فى حمام مائي ليعطي مشتق الكلوروكينازولين (21) يتفاعل الكلوروكينازولين (21) مع النيوكليوفيلات مثل:- ا- النيوكليوفيلات الكبريتية مثل: حمض ثيوجليكوليك، الثيويوريا والثيوفينول ليعطى المركبات (22)، (23)، (24) على الترتيب. ب- النيوكليوفيلات النيتروجينية مثل:- صوديوم أزيد، الببريدين وأورثوأمينو فينول ليعطي مشتقات الكينازولين (25)، (26)، (27) على الترتيب.عندما يتفاعل الكلوروكينازولين (21) مع الهيدرازين هيدرات في البيوتانول فإنه يعطي مشتق الهيدرازينوكينازولين (28).المركب (28) يمكن أن يتفاعل مع ثنائي كبريتيد الكربون ليعطي المركب (29). المركب (28) يتفاعل مع البنزالدهيد في البيوتانول ليعطي مشتق الهيدرازون (30).الكلوروكينازولين (21) يتفاعل أيضاً مع النيوكليوفيلات الكربونية مثل أسيتيل أسيتون في وجود إيثوكسيد الصوديوم وفي البيوتانول ليعطي الكينازولينيل بروبانون (31). بمفاعلة الكلوروكينازولين (21) مع السلفونيلميد في ثنائي ميثيل فورماميد فإنه يعطي كينازولينيا-بنزين سلفونميد (32).تم دراسة النشاط البيولوجى لجميع المركبات المحضرة ووجد أن بعضها له نشاط مبشر.