



# SardiniaChem 2006

GIORNATA DI STUDIO DEDICATA ALLA CHIMICA ORGANICA  
DELLE MOLECOLE BIOLOGICAMENTE ATTIVE

5 Giugno 2006, Complesso Universitario di Monserrato, Cagliari



## COMITATO ORGANIZZATORE:

Salvatore Cabiddu - Università di Cagliari, Giovanna Delogu - CNR Sassari,  
Pier Paolo Piras - Università di Cagliari, Giampaolo Giacomelli - Università di Sassari

## HANNO CONTRIBUITO ALLA REALIZZAZIONE DEL CONVEGNO:

UNIVERSITÀ DI CAGLIARI; UNIVERSITÀ DI SASSARI-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di  
Chimica Biomolecolare, Sezione di Sassari; SIGMA-ALDRICH Srl; EXACTA+OPTTECH Sardegna S.r.l.,  
CARLO ERBA REAGENTI; VWR INTERNATIONAL s.r.l.

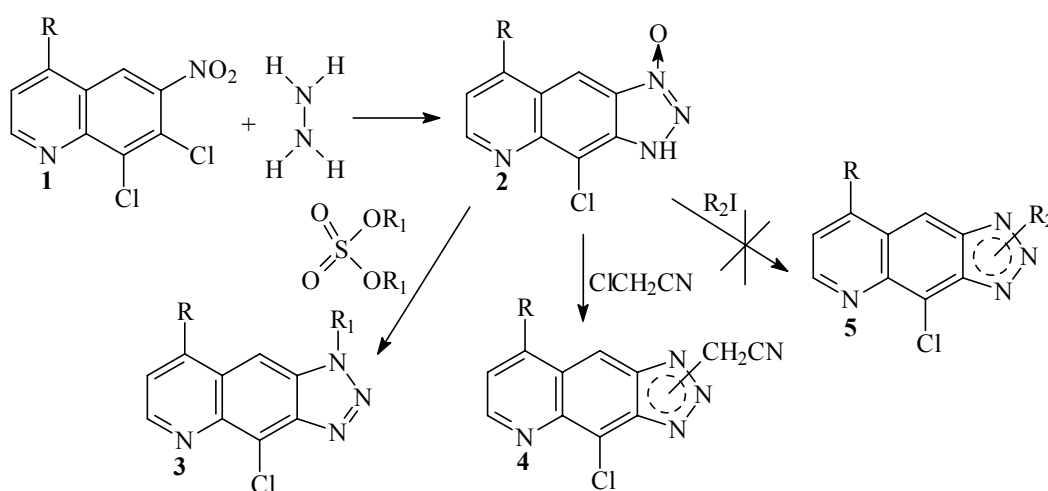
## SINTESI DI TRIAZOLO[4,5-g]CHINOLINE A POTENZIALE ATTIVITÀ BIOLOGICA

A. Carta, A. Busellu, G. Loriga, M. Palomba, A. Senes e G. Paglietti

*Dipartimento Farmaco-Chimico-Tossicologico, Università degli Studi di Sassari, Via Muroni 23/a, 07100 Sassari, Italia*

Recentemente sono stati descritti da alcuni di noi (A.C., M.P., G.P., ed altri) nuovi derivati (oltre 150) a struttura 3-aryl-2-[1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-il]acrilonitrili, e i loro corrispondenti acidi e ammidi, dotati di attività antiproliferativa e antitubercolare [1-5] che arricchiscono l'elenco delle già note proprietà biologiche dei derivati benzotriazolici [5-7]. Sulla base di queste indicazioni si è pensato di valutare l'effetto dell'anellazione del nucleo piridinico al benzotriazolo sulle proprietà biologiche. In una prima ipotesi sono stati sintetizzati la triazolo[4,5-*g*]chinolina [8] e il suo corrispondente *N*<sub>1</sub>-ossido [9].

In questa comunicazione viene elaborata una nuova via sintetica che consente di ottenere i derivati funzionalizzati in posizione 8 (**2**), utilizzando come sintone la nitrocloroquinolna (**1**) la cui procedura di preparazione è descritta in un altro poster. Le reazioni di alchilazione dei composti (**2**) sono condizionate dalla natura dell'agente alchilante. Si è infatti osservato che la reazione di (**2**) con solfato di alchile fornisce un unico derivato proveniente dalla sostituzione dell'ossigeno con l'alchile (**3**), laddove utilizzando differenti alchilanti si ottengono miscele di isomeri di alchilazione sui diversi atomi di *N* (cloroacetonitrile) (**4**) o nessun prodotto di reazione (alchil-ioduri) (**5**).



**Bibliografia**

- [1] P. Sanna, A. Carta, M.E. Rahbar Nikoogar, Synthesis and antitubercular activity of 3-aryl substituted-2-(1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-yl)acrylonitriles, *Eur. J. Med. Chem.* 35 (2000) 535-543.
- [2] P. Sanna, A. Carta, L. Gherardini, M.E. Rahbar Nikoogar, Synthesis and antimycobacterial activity of 3-aryl- 3-cyclohexyl- and 3-heteroaryl- substistuted-2-(1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-yl)prop-2-enenitriles, prop-2-enamides and propenoic acids, *II Farmaco* 57 (2002) 79-87.
- [3] A. Carta, P. Sanna, M. Palomba, L. Vargiu, M. La Colla, R. Loddo, Synthesis and antiproliferative activity of 3-aryl-2-(1*H*-benzotriazol-1-yl)acrylonitriles. Part III, *Eur. J. Med. Chem.* 37 (2002) 891-900.
- [4] A. Carta, M. Palomba, G. Boatto, B. Busonera, M. Murreddu, R. Loddo, Synthesis and antiproliferative activity of 3-aryl-2-(1*H*(2*H*)-benzotriazol-1(2)-yl)acrylonitriles variously substituted. Part 4, *II Farmaco*, 59 (2004) 637-644.
- [5] G. Paglietti, P. Sanna, A. Carta, F. Sparatore, I. Vazzana, A. Peana, M. Satta, Choleric activity of 3 [ring substituted benzotriazol-1(2)-yl]alkanoic and alkenoic acids. *II Farmaco*, 49 (1994) 693-702.
- [6] A. Carta, C. Congiatu, M. Loriga, E. Marongiu, F. Esposito, R. Loddo, Synthesis and biological evaluation of N-[4-(1(2)*H*(benzotriazol-1(2)yl-phenylalkyl)carboxamido and N,N'-bis-[4-(1(2)*H*(benzotriazol-1(2)yl-phenylalkyl)dicarboxamido derivatives Polish-Austrian-German-Hungarian-Italian Joint Meeting on Medicinal Chemistry, Krakow, Poland, 15-18 October 2003. Book of abstracts P148, p182.
- [7] A. Carta, M. Loriga, S. Piras, B. Secci, A. Visioli, P. La Colla, Synthesis and *in vitro* evaluation of the antiviral activity of a series of novel N-[4-(1*H*(2*H*)-Benzotriazol-1(2)-yl)phenyl]alkylcarboxamides, Second Joint Italian-Swiss Meeting on Medicinal Chemistry, September 12-16, 2005. Modena, Italy. Atti P. 43 p. 119.
- [8] P. Sanna, A. Carta, G. Paglietti, Synthesis of triazolo[4,5-*g*]quinolines and pyrido[2,3-*g*]quinoxalines derived from 6,7-diaminoquinolines. *Heterocycles*, 53 (2000) 423-432.
- [9] A. Carta, G. Paglietti, A new synthesis of triazolo[4,5-*g*]quinolines and unexpected ring reduced products by treatment with hydrazine hydrate, *ARKIVOC*, V (2004) 66-75.