



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:

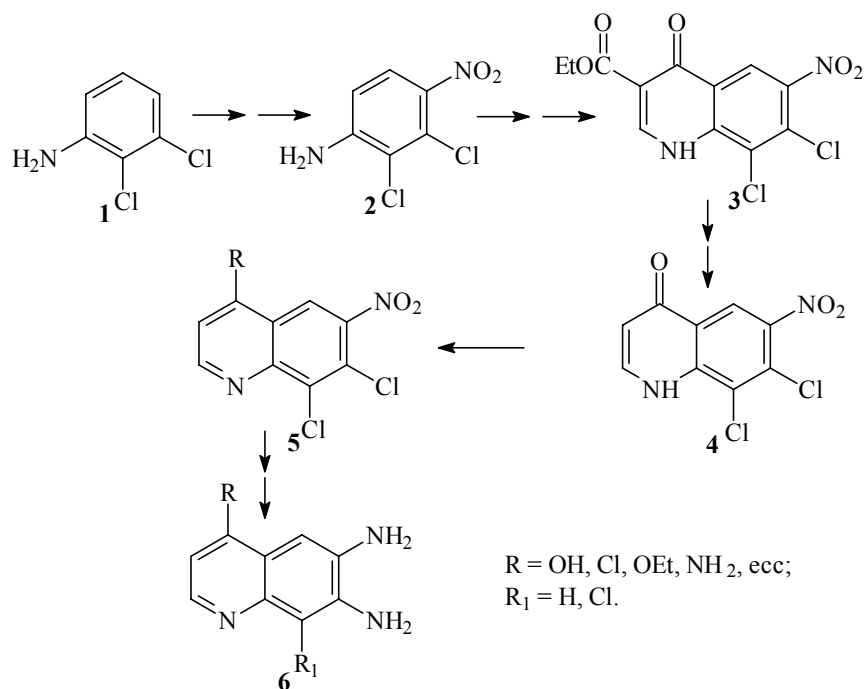
UNIVERSITÀ DI CAGLIARI; UNIVERSITÀ DI SASSARI-Dipartimento di Chimica; CNR-Istituto di
Chimica Biomolecolare, Sezione di Sassari; SIGMA-ALDRICH Srl; EXACTA+OPTTECH Sardegna S.r.l.,
CARLO ERBA REAGENTI; VWR INTERNATIONAL s.r.l.

SINTESI DI NUOVE 6,7-DIAMMINOCHINOLINE QUALI INTERMEDI PER LA PREPARAZIONE DI MOLECOLE AD ATTIVITÀ BIOLOGICA

A. Carta, C. Giua, S. Piras, A. Sias, G. Loriga e G. Paglietti

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

Le amminochinoline rappresentano una classe di sintoni molto utilizzate dal nostro gruppo di ricerca per la sintesi di nuovi sistemi tricyclici aromatici. In quest'ottica sono stati preparati e opportunamente funzionalizzati alcuni nuovi nuclei quali triazolo[4,5-g]chinolina, imidazo[4,5-g]chinolina, pirido[2,3-g]chinossalina e 4,7-fenatrolina che sono risultati dotati di attività biologica [1-5]. In questa comunicazione viene affrontato un nuovo approccio alla sintesi di 6,7-diamminochinoline indispensabili per ottenere sintoni tricyclici lineari da funzionalizzare nello spezzone piridinico della molecola. A tale scopo è stato individuato come prodotto di partenza il chinolone (**3**), facilmente ottenibile in buone rese secondo la reazione di Gould-Jacobs dall'anilina (**2**), seguita da idrolisi e decarbossilazione per dare il chinolone (**4**). Questo intermedio consente la funzionalizzazione della posizione 4 con un cloro, etossile, ammino, ecc., e a seconda delle condizioni usate la sostituzione nucleofila del cloro con un gruppo amminico in C-7. La successiva riduzione del nitrogruppo può portare sia alla diammina con il cloro in posizione 8 che senza questo alogeno, consentendo così di approntare due serie di sistemi tricyclici.



Nel poster verranno inoltre descritte ulteriori procedure adottate per l'ottenimento di altri derivati aminochinolinici.

Bibliografia

- [1] 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.
- [2] A. Carta, G. Boatto, G. Paglietti, G. Poni, M.G. Setzu, P. Caredda, Synthesis and biological evaluation of triazolo[4,5-g]quinolines, imidazo[4,5-g]quinolines and pyrido[2,3-g]quinoxaline. Part II, *Heterocycles*, 60 (2003) 833-842.
- [3] 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.
- [4] A. Carta, M. Loriga, G. Paglietti, M. Ferrone, S. Pricl, M.A. Piano, M. Meloni, P. La Colla, Synthesis and antiviral activity of 4,7-Phenantroline derivatives against RNA Viruses, Second Joint Italian-Swiss Meeting on Medicinal Chemistry, September 12-16, 2005. Modena, Italy. Atti P. 42 p. 118.
- [5] A. Carta, P. Sanna, L. Gherardini, D. Usai, S. Zanetti, Novel functionalized pyrido[2,3-g]quinoxalinones as antibacterial, antifungal and anticancer agents, *Il Farmaco*, 56 (2001) 993-998.