

A 2-naftol nitrogén-tartalmú analógjainak transzformációi

The transformation of nitrogen-containing analogues of 2-naphthol

CSUVIK Oszkár^{1,2}, Prof. dr. FÜLÖP Ferenc^{1,2},
dr. CSÁMPAI Antal³, dr. SZATMÁRI István^{1,2}

¹Institute of Pharmaceutical Chemistry and Stereochemistry Research Group of Hungarian Academy of Sciences, University of Szeged, Eötvös u. 6, H-6720 Szeged, Hungary

²Institute of Pharmaceutical Chemistry, University of Szeged, Interdisciplinary Excellence Centre,

³Institute of Chemistry, Eötvös Loránd University, H-1518 Budapest, PO Box 32, Hungary
oszkar.csuvisk@pharm.u-szeged.hu

ABSTRACT

The Mannich reaction can be used to form C–C bond that takes place between three reactants under relatively mild reaction conditions. The modified Mannich reaction (*mMR*) involves an aldehyde, an amine and an electron rich aromatic compound (for instance 1- or 2-naphthol), and results an aminoalkyl derivative. During our work, we have examined 6-hydroxyquinoline (6HQ) and 3-hydroxyisoquinoline (3HIQ) as nitrogen-containing 2-naphthol analogues. When the aminoalkylation of these electron rich aromatic substances was tested, the 5-substituted derivative was synthesised in case of 6HQ; but in contrast, 3HIQ showed an unexpected reactivity. Two main product types were identified, from which the first one is the classical aminoalkylated derivative, and the other is a 4-benzylidene-1-morpholino-lactam derivative. The ratio of the formed products was examined systematically, when the effect of aldehyde component on product selectivity was tested, regarding the length of the reaction time.

Keywords: Mannich reaction, 2-naphthol, 6-hydroxyquinoline, 3-hydroxyisoquinoline

KIVONAT

A Mannich reakció egy C–C kötés kialakítására alkalmas eljárás, amely három reaktáns között játszódik le viszonylag enyhe reakciókörülmények között. A módosított Mannich reakció (*mMR*) egy aldehid, egy amin és egy elektrondús aromás vegyület (mint például 1- vagy 2-naftol) részvételével játszódik le, egy aminoalkil származékot eredményezve. Munkánk során a 6-hidroxikinolint (6HQ) és a 3-hidroxiiizokinolint (3HIQ), mint nitrogén-tartalmú 2-naftol analógokat vizsgáltuk. Ezen elektrondús aromás vegyületek aminoalkilezése során a 6HQ esetén előállítottuk az 5-szubsztituált származékot, viszont a 3HIQ alkalmazásakor eltérő reaktivitást tapasztaltunk. Két fő terméktípust azonosítottunk, amelyek közül az egyik a klasszikus aminoalkil vegyület, míg a másik egy 4-benzilidén-1-morfolino-laktám származék. Szisztematikusan vizsgáltuk a két termék képződési arányát, mely során teszteltük az aldehidkomponens hatását a termékszelektivitásra, illetve reakcióidő hosszának szerepét.

Kulcsszavak: Mannich reakció, 2-naftol, 6-hidroxikinolin, 3-hidroxiiizokinolint