

# СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ ИПИДАКРИНА, СОДЕРЖАЩИХ ФРАГМЕНТЫ АМИНОСПИРТОВ

Вяткина К.А.<sup>(1,2)</sup>, Худина О.Г.<sup>(2)</sup>, Грищенко М.В.<sup>(2)</sup>,  
Махаева Г.Ф.<sup>(3)</sup>, Бургарт Я.В.<sup>(2)</sup>, Салоутин В.И.<sup>(2)</sup>

<sup>(1)</sup> Уральский федеральный университет  
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

<sup>(2)</sup> Институт органического синтеза УрО РАН  
620137, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, д. 22

<sup>(3)</sup> Институт физиологически активных веществ РАН  
142432, г. Черноголовка, Северный проезд, д. 1

Разработан синтез новых производных антихолинэстеразного препарата ипидакрин, содержащих гидроксиполиметиленовый фрагмент, который в дальнейшем будет использован как спейсер для конъюгации с различными фармакофорами с целью получения мультифункциональных агентов терапии болезни Альцгеймера. Соединения **2a-c** синтезированы реакцией 9-хлор-2,3,5,6,7,8-гексагидро-1H-циклопента[b]хинолина **1** с 8-кратным избытком 2-аминоэтанола, 3-амино-1-пропанола или 6-амино-1-гексанола в присутствии каталитического количества KI (см. схему). Аминоспирт использовали как реагент и растворитель. Промывание реакционной массы водой благодаря её смешиваемости с аминоспиртами позволило выделить продукты **2a-c** с выходами 90-98%. В аналогичных условиях получено также производное ипидакрина **3**, содержащее фрагмент 3-амино-2-пропанола. Присутствие в спейсере OH-функции должно привести к специфическим взаимодействиям синтезируемых далее конъюгатов с ферментами. Предложенный способ был апробирован для получения 6-аминогексильного производного **4**, который нами широко применяется для синтеза конъюгатов.

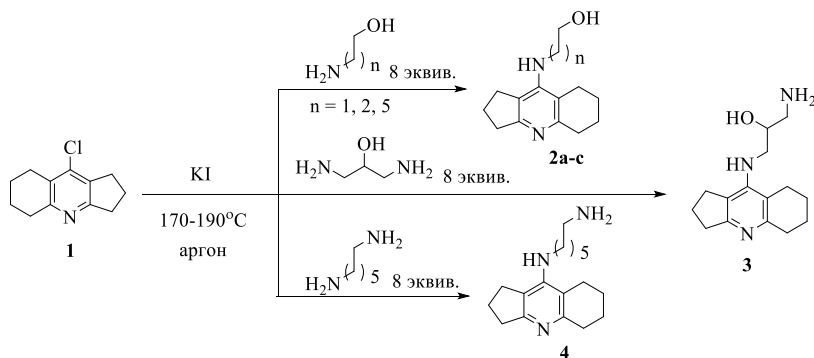


Схема синтеза производных ипидакрина

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (проект № 24-63-00016).