

Síntesis de derivados de 5-arilquinolina a través de una nueva reacción de acoplamiento de arilmagnesianos

Raquel Arroyo Rodríguez

raquel.arro@gmail.com

Tutores

José Carlos Méndez Ramos. Riccardo Egris. Mercedes Villacampa Sanz

Resumen: Debido a la importancia farmacológica del núcleo de quinolina, y como continuación de nuestros estudios acerca de reacciones entre nitroarenos y vinilmagnesianos,¹ describimos aquí la síntesis de materiales de partida derivados de quinolina (5-metoxi-6-nitroquinolin-2-ona **1** y 5-metoxi-6-nitroquinolina **2**) y su posterior su reacción con bromuros de arilmagnesio, con la finalidad de obtener derivados de quinolina inaccesibles por los métodos convencionales para su empleo posterior en la síntesis de compuestos bioactivos.

La preparación de los compuestos de partida se basa en la síntesis de Knorr, y supone la acetoacetilación de la 2,5-dimetoxianilina con 2,2,6-trimetil-1,3-dioxin-4-ona seguida de ciclación en presencia de ácido sulfúrico. Tras la nitración de la posición 6, se procede a la metilación quimioselectiva del nitrógeno o el oxígeno del grupo de lactama, resultando respectivamente los compuestos **1** y **2**.

Estos productos se tratan con los arilmagnesianos a varias temperaturas, resultando los correspondientes derivados de arilación. Se ha observado que en las reacciones que parten de **1** se puede obtener o bien la C-arilación en la posición 5 de la quinolina, o bien una N-arilación del grupo nitro, mientras que cuando se parte de **2** se obtienen únicamente productos de C-arilación en 5. Además del tipo de sustrato, hay otros factores que influyen sobre resultado de la reacción, incluyendo la temperatura, el tipo de magnesiano y el disolvente.

Palabras clave: Quinolinas. Carbostirilos. Magnesianos. Arilación.

Bibliografía:

- 1 (a) Sánchez, J. D.; Avendaño, C.; Menéndez, J. C. *Synlett* 2008, 1371.
(b) Egris, R.; Villacampa, M.; Menéndez, J. C. *Chem. Eur. J.* 2009, 15, 10930.

Investigación Básica
Póster

Recibido: 25 marzo 2011.
Aceptado: 30 marzo 2011.