

جمهوری اسلامی ایران
وزارت علوم، تحقیقات و فناوری



گروه شیمی

پایان نامه:

کارشناسی ارشد رشته شیمی (گرایش آلی)

عنوان:

سنتز مشتقات ۲- بنزیلیدین - ۸،۸- دی متیل - (۵- آریل) - ۹،۸- دی هیدرو -
۲H- تiazولو [۲،۳-b] کینازولین - ۶،۳ (۷H، ۵H) - دی آن

استاد راهنما:

پروفسور ناصر فروغی فر

استاد مشاور:

دکتر اکبر مبینی خالدی

پژوهشگر:

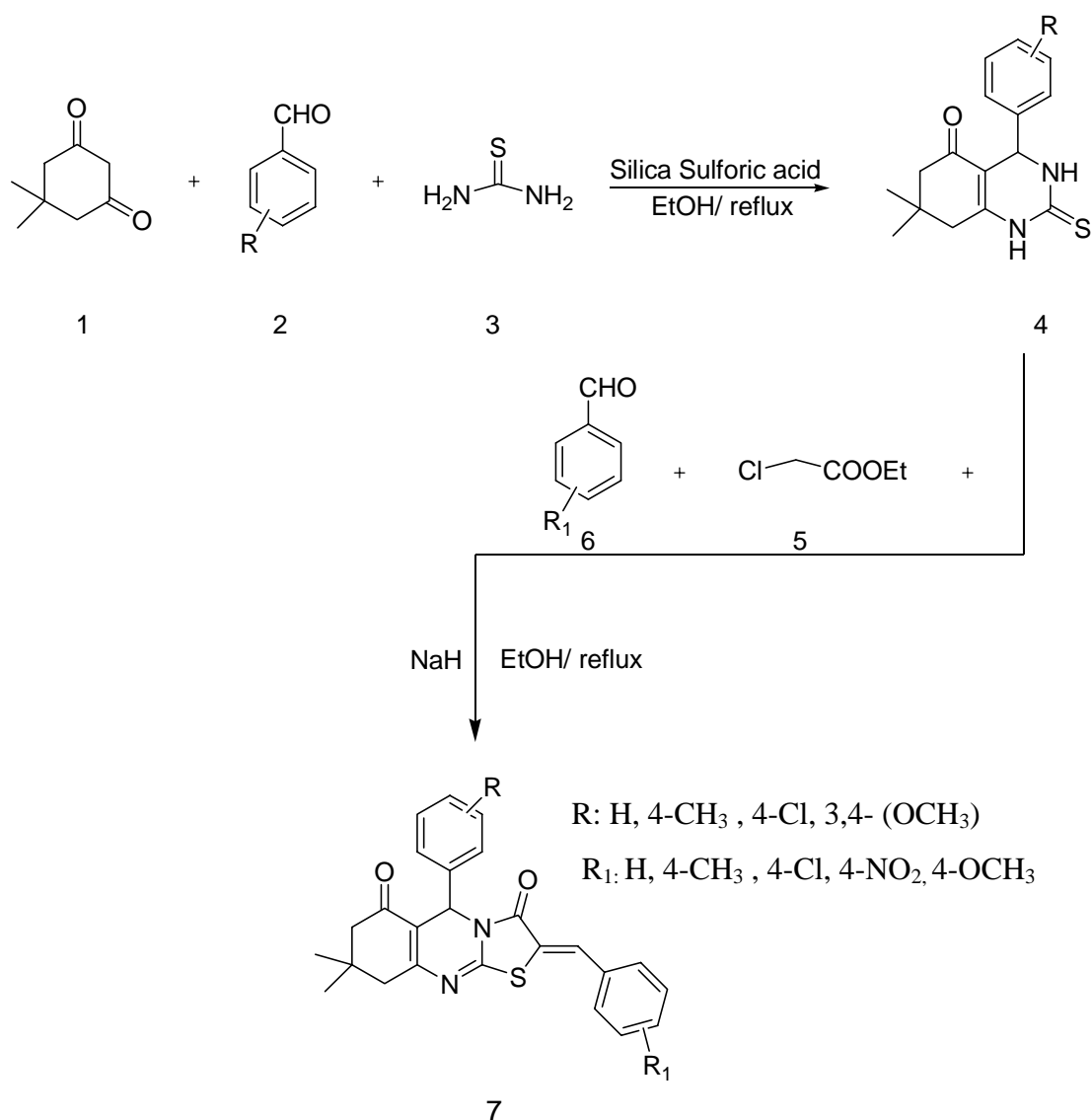
فاطمه رحیمی

مهر ماه ۱۳۸۸

چکیده:

مشتقات اکتاهیدروکینازولین (۴) از طریق واکنش حلقه زایی بیجینلی ۵، ۵-دی متیل-۱، ۳-سیکلوهگزادی آن (۱)، بنزالدهیدهای آروماتیک (۲) و تیوآوره (۳) با راندمان (۷۰-۸۵٪) تهیه شدند؛ سپس مشتقات تiazolidینی (۷) با استفاده از مشتقات اکتاهیدروکینازولین (۴)، اتیل کلرواستات (۵)، آلدهیدهای آروماتیک (۶) و سدیم هیدرید به عنوان قلیا در حلال اتانول تحت شرایط رفلاکس به صورت تک مرحله ای، سنتز شدند.

ترکیبات تهیه شده با استفاده از روش های طیف سنجی IR، $^1\text{H-NMR}$ ، $^{13}\text{C-NMR}$ و آنالیز عنصری شناسایی شدند.



عنوان صفحه

فصل اول: مقدمه و تئوری

- ۱-۱) هتروسیکل ها ۱
- ۱-۱-۱) اهمیت و تاریخچه ۱
- ۱-۱-۲) اهمیت ترکیبات هتروسیکل طبیعی در زندگی ۱
- ۱-۱-۳) اهمیت ترکیبات هتروسیکل سنتزی در زندگی ۵
- ۱-۱-۴) پیریمیدین ها ۸
- ۱-۱-۵) کاربرد پیریمیدین ها ۹
- ۱-۱-۶) سنتز پیریمیدین ها ۱۰
- ۱-۱-۷) کینازولین ها ۱۲
- ۱-۱-۸) ساختار و واکنش پذیری کینازولین ها ۱۲
- ۱-۱-۹) تiazولیدین ها و خواص شیمیایی آن ها ۱۳
- ۱-۱-۱۰) خواص دارویی و بیولوژیکی تiazولیدین ها ۱۴
- ۱-۱-۱۱) روش های سنتز حلقه تiazولیدین -۴- آن ۱۵
- ۱-۱-۱۲) واکنش های حلقه تiazولیدین -۴- آن ۱۷
- ۱-۱-۱۳) واکنش های چندجزئی ۲۲

فصل دوم: بخش تجربی

- دستگاه های اندازه گیری نقطه ذوب و طیف سنجی ۲۵
- ۲-۱) مواد اولیه ۲۵

- ۲۵ ۱-۲-۱) ۵، ۵- دی متیل- ۱، ۳- سیکلو هگزا دی آن (دی مدن)
- ۲۵ ۲-۱-۲) تیوآوره
- ۲۵ ۳-۱-۲) اتیل کلرواستات
- ۲۶ ۴-۱-۲) سدیم هیدرید
- ۲۶ ۵-۱-۲) آلدهیدهای آروماتیک
- ۲۶ ۶-۱-۲) سیلیکا سولفوریک اسید
- ۲۷ ۲-۲) روش کلی سنتز ترکیبات کینازولین اولیه
- ۲۸ ۳-۲) مشخصات ترکیبات کینازولین اولیه
- ۲۸ ۱-۳-۲) ۴- (۴- کلروفنیل)- ۷، ۷- دی متیل- ۵- اکسو- ۱، ۲، ۳، ۴، ۵، ۶، ۷- اکتاهید
- ۲۸ رو کینازولین- ۲- تی آن (۴a)
- ۲۸ ۲-۳-۲) ۴- فنیل- ۷، ۷- دی متیل- ۵- اکسو- ۱، ۲، ۳، ۴، ۵، ۶، ۷ و ۸- اکتاهیدروکینا
- ۲۹ زولین- ۲- تی آن (۴b)
- ۲۹ ۴-۲) تهیه مشتقات ۲- بنزیلیدن- ۸، ۸- دی متیل- (۵- آریل)- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-
- ۳۰ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H)- دی آن
- ۳۲ ۵-۲) مشخصات ترکیبات سنتزی جدید
- ۳۲ ۱-۵-۲) ۲- بنزیلیدن- ۸، ۸- دی متیل- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو، [۳-b،
- ۳۳ [۲ کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H)- دی آن (۷a)
- ۳۳ ۲-۵-۲) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- نیتروبنزیلیدن)- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-
- ۳۴ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H)- دی آن (۷b)
- ۳۴ ۳-۵-۲) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-

- ۳۵ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷c)
 ۲-۵-۴ (۲-۵-۴) ۲- بنزیلیدن- ۸، ۸- دی متیل- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو
- ۳۶ [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷d)
 ۲-۵-۵ (۲-۵-۵) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-
- ۳۷ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷e)
 ۲-۵-۶ (۲-۵-۶) ۲- (۴- کلرو بنزیلیدن) ۸، ۸- دی متیل- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-
- ۳۸ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷f)
 ۲-۵-۷ (۲-۵-۷) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- نیتروبنزیلیدن) - ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H-
- ۳۹ تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷g)
 ۲-۵-۸ (۲-۵-۸) ۲- بنزیلیدن- ۵- (۴- کلروفنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو
- ۴۱ [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷h)
 ۲-۵-۹ (۲-۵-۹) ۵- (۴- کلروفنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۸، ۹- دی هیدرو-
- ۴۲ ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷i)
 ۲-۵-۱۰ (۲-۵-۱۰) ۲- بنزیلیدن- ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل) - ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی هیدرو-
- ۴۳ هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷j)
 ۲-۵-۱۱ (۲-۵-۱۱) ۴- کلرو بنزیلیدن- ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی هیدرو-
- ۴۴ هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷k)
 ۲-۵-۱۲ (۲-۵-۱۲) ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل)- ۲- (۴- متوکسی بنزیلیدن)- ۸، ۸- دی متیل-
- ۴۵ ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H) -دی أن (۷l)

فصل سوم: بحث و نتیجه گیری

- ۳-۱) نتایج طیف‌های IR و NMR ۴۷
- ۳-۱-۱) ۲- بنزیلیدن- ۸، ۸- دی متیل- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۳-b] ۴۷
- ۲، [۲، ۳-ب] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷a) ۴۷
- ۳-۱-۲) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- نیتروبنزیلیدن)- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷b) ۴۸
- ۳-۱-۳) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۵- فنیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷c) ۴۹
- ۳-۱-۴) ۲- بنزیلیدن- ۸، ۸- دی متیل- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [b] ۵۱
- ۲، ۳ [۲، ۳-ب] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷d) ۵۱
- ۳-۱-۵) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷e) ۵۳
- ۳-۱-۶) ۲- (۴- کلرو بنزیلیدن) ۸، ۸- دی متیل- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷f) ۵۴
- ۳-۱-۷) ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- نیتروبنزیلیدن)- ۵- پاراتولیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷g) ۵۶
- ۳-۱-۸) ۲- بنزیلیدن- ۵- (۴- کلروفنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷h) ۵۸
- ۳-۱-۹) ۵- (۴- کلروفنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۲- (۴- متیل بنزیلیدن)- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷i) ۶۰
- ۳-۱-۱۰) ۲- بنزیلیدن- ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (ΔH، ۷H)- دی‌آن (۷j) ۶۱

- ۱۱-۱-۳) ۴- کلرو بنزیلیدن- ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل)- ۸، ۸- دی متیل- ۸، ۹- دی-
 هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H)- دی آن (۷k) ۶۳
 ۱۲-۴-۲) ۵- (۳، ۴- دی متوکسی فنیل)- ۲- (۴- متوکسی بنزیلیدن)- ۸، ۸- دی متیل-
 ۸، ۹- دی هیدرو- ۲H- تiazولو [۲، ۳-b] کینازولین- ۳، ۶ (۷H، ۵H)- دی آن (۷l) ۶۴

فصل چهارم : طیف‌ها

- ۶۷ طیف FT-IR ترکیب (۴a)
 ۶۸ طیف ¹H-NMR ترکیب (۴a)
 ۶۹ طیف FT-IR ترکیب (۴b)
 ۷۰ طیف ¹H-NMR ترکیب (۴b)
 ۷۱ طیف FT-IR ترکیب (۷a)
 ۷۲ طیف ¹H-NMR ترکیب (۷a)
 ۷۳ طیف FT-IR ترکیب (۷b)
 ۷۴ طیف ¹H-NMR ترکیب (۷b)
 ۷۶ طیف FT-IR ترکیب (۷c)
 ۷۷ طیف ¹H-NMR ترکیب (۷c)
 ۷۸ طیف FT-IR ترکیب (۷d)
 ۷۹ طیف ¹H-NMR ترکیب (۷d)
 ۸۱ طیف ¹³C-NMR ترکیب (۷d)
 ۸۲ طیف FT-IR ترکیب (۷e)
 ۸۳ طیف ¹H-NMR ترکیب (۷e)
 ۸۵ طیف ¹³C-NMR ترکیب (۷e)

٨٦	طيف FT-IR تركيب (٧f)
٨٧	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧f)
٨٩	طيف $^{13}\text{C-NMR}$ تركيب (٧f)
٩٠	طيف FT-IR تركيب (٧g)
٩١	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧g)
٩٢	طيف $^{13}\text{C-NMR}$ تركيب (٧g)
٩٣	طيف FT-IR تركيب (٧h)
٩٤	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧h)
٩٦	طيف $^{13}\text{C-NMR}$ تركيب (٧h)
٩٧	طيف FT-IR تركيب (٧i)
٩٨	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧i)
٩٩	طيف FT-IR تركيب (٧j)
١٠٠	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧j)
١٠١	طيف $^{13}\text{C-NMR}$ تركيب (٧j)
١٠٢	طيف FT-IR تركيب (٧k)
١٠٣	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧k)
١٠٥	طيف $^{13}\text{C-NMR}$ تركيب (٧k)
١٠٦	طيف FT-IR تركيب (٧l)
١٠٧	طيف $^1\text{H-NMR}$ تركيب (٧l)
١٠٩	منابع

مقدمه

(۱-۱) هتروسیکل‌ها

(۱-۱-۱) اهمیت و تاریخچه: [۱-۵]

ترکیبات حلقوی شامل اتم‌های کربن که یک یا تعداد بیشتری از اتم‌های کربن حلقه با عناصر دیگری جایگزین شوند، هتروسیکل نامیده می‌شوند. متداولترین عناصری که در ساختار هتروسیکل‌ها شرکت دارند اکسیژن، گوگرد و نیتروژن می‌باشند. هتروسیکل‌ها طبقه وسیعی از ترکیبات آلی را در بر می‌گیرند و به صورت آروماتیک و غیرآروماتیک یافت می‌شوند. شیمی هتروسیکل‌های آروماتیک برگرفته از سه کشف مختلف است [۱]:

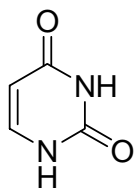
جداسازی چندین مشتق فوران از مواد گیاهی در سال ۱۷۸۰.

کشف پیرول از طریق تقطیر خشک استخوان و شاخ در سال ۱۸۳۴.

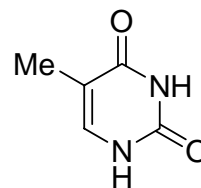
جداسازی پیکولین از قطران زغال سنگ در سال ۱۸۴۶.

(۱-۱-۲) اهمیت ترکیبات هتروسیکل طبیعی در زندگی: [۳، ۵]

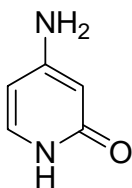
بسیاری از ترکیبات هتروسیکل توسط گیاهان و حیوانات بیوسنتز شده و از لحاظ زیست‌شناختی فعال‌اند. همچنین برخی از این ترکیبات برای ادامه حیات ضروری هستند. به عنوان مثال پیریمیدین‌های اوراسیل (۱)، تیمین (۲)، و سیتوزین (۳)، به دلیل آنکه اجزای اسیدهای نوکلئیک هستند به صورت مشتقات *N* استخلاف شده قندی (نوکلئوزیدها) در سطح وسیعی در طبیعت یافت می‌شوند.



(۱)

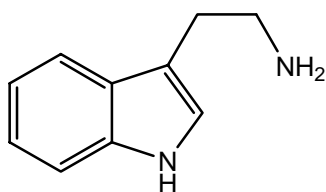


(۲)

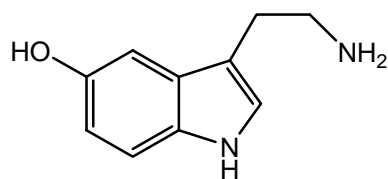


(۳)

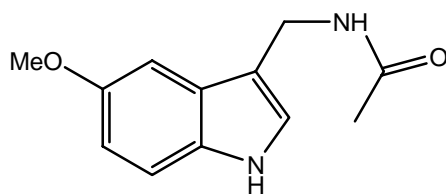
بسیاری از ساختارهای ایندولی از لحاظ زیست شناختی مهم هستند، مانند تریپتامین (۴)، که پیش ماده دو هورمون سرتونین (۵) و ملاتونین (۶)، می باشد.



(۴)

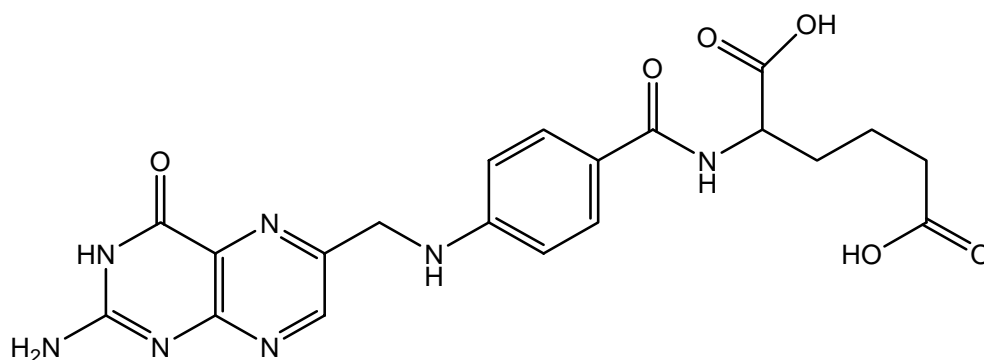


(۵)



(۶)

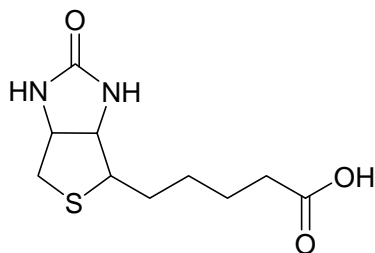
اسید فولیک (۷)، که مشتق پتریدین است، یک عامل رشد طبیعی می باشد که مورد نیاز تمام حیوانات است.



(۷)

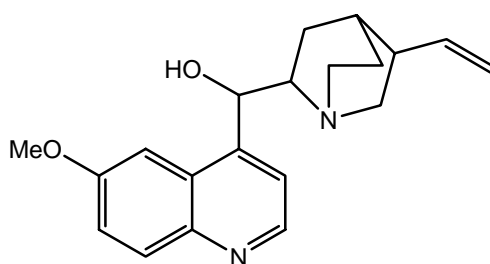
بیوتین (۸)، یک حلقه تتراهیدروتیوفن دارد و مهم‌ترین تیوفن طبیعی است، این ترکیب یک

عامل مهم رشد است.



(۸)

عامل ضد مالاریای کینین^۱ (۹)، نیز از پوست درخت سینکونا^۲ استخراج شده است.

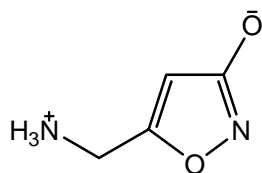


(۹)

-
- ۱-Quinine
۲-Cinchona

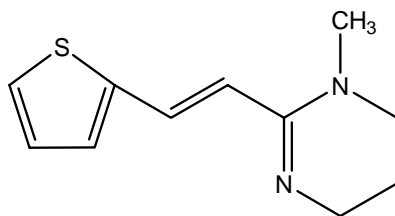
موسیمول (۱۰)، یک ایزوکسازول طبیعی است، که از قارچ آمانیتاموسکاریا^۱ مشتق شده و اثر

تقویت روانی دارد.



(۱۰)

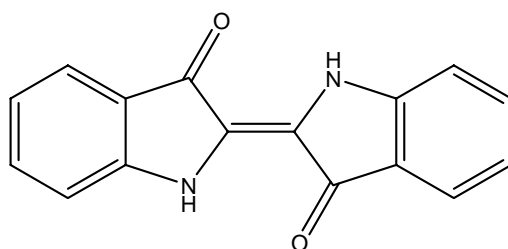
پیرانتل (۱۱)، تیوفنی است، که به عنوان عامل ضد کرم استفاده می شود.



(۱۱)

از جمله رنگینه های دارای منشأ گیاهی، رنگینه آبی نیلی است (۱۲)، که از آن برای رنگ

کردن لباس ها استفاده می شود.



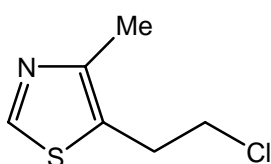
(۱۲)

^۱-Amanita Muscaria

۳-۱-۱) اهمیت ترکیبات هتروسیکل سنتزی:

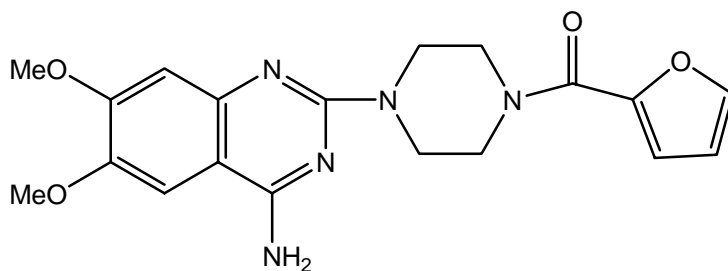
هتروسیکل‌های سنتزی دارای کاربردهای بسیار وسیع در زمینه‌های دارویی، کشاورزی، صنایع غذایی و ... می‌باشند. نمونه‌هایی از این ترکیبات عبارتند از:

کلومیترائول (۱۳)، یک داروی ضد اضطراب، آرام بخش و خواب آور بوده و فعالیت دارویی این ترکیب مربوط به حضور گروه تiazol در ساختار آن می‌باشد [۶].



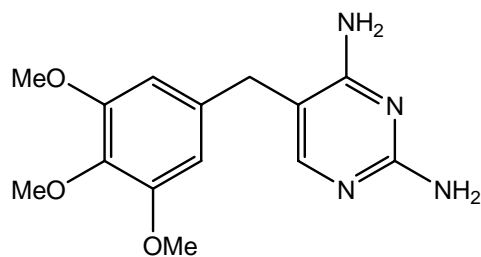
(۱۳)

داروی پرازوسین (۱۴)، ضد فشار خون بوده و در دسته کینازولین‌ها قرار دارد [۵].



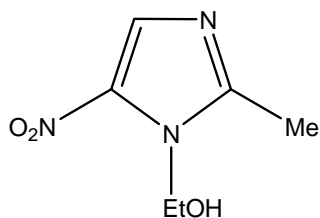
(۱۴)

عامل شیمی درمانی تریمتوپریم (۱۵)، دارای یک گروه تریمتوکسی بنزیل است [۶].



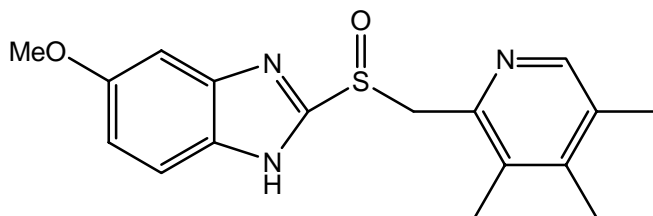
(۱۵)

داروی مترونیدازول (۱۶)، که یک ترکیب نیتروایمیدازولی می‌باشد، در درمان عفونت‌های گوارشی استفاده می‌شود [۶].



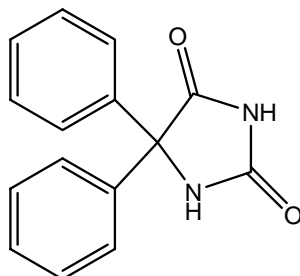
(۱۶)

امپرازول (۱۷)، بنزوایمیدازولی است که در درمان زخم‌های معده و اثنی‌عشر استفاده می‌شود [۶].



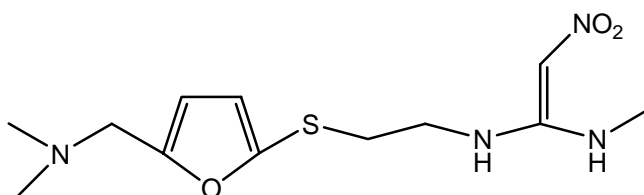
(۱۷)

ترکیب فنی توئین (۱۸)، داروی ضد صرع می‌باشد که ساختار ایمیدازولیدین دارد [۶].



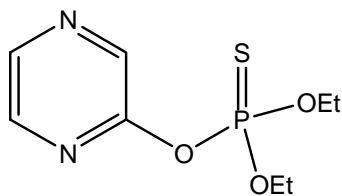
(۱۸)

رانیتیدین (۱۹)، در درمان بیماری‌های معده استفاده می‌شود [۵].



(۱۹)

حشره‌کش خاک تیونازین (۲۰)، نمونه‌ای از ساختارهای پیرازینی است [۵].

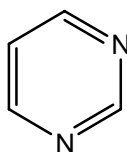


(۲۰)

۴-۱-۱) پیریمیدین‌ها: [۵]

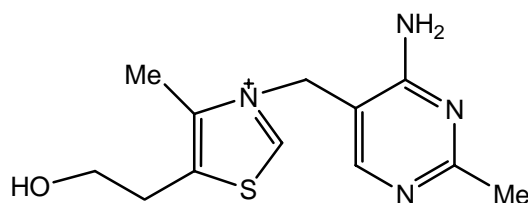
هتروسیکل‌های شش عضوی که دارای دو، سه و چهار اتم نیتروژن در حلقه هستند به طور سیستماتیک دی‌آزین‌ها، تری‌آزین‌ها و تترازین‌ها نامیده می‌شوند.

پیریمیدین‌ها (۱،۳-دی‌آزین‌ها) (۲۱)، مهم‌ترین عضو دی‌آزین‌ها می‌باشند. این ترکیبات مانند بنزن خصلت آروماتیکی دارند ولی انرژی رزونانس آن‌ها از بنزن کمتر است.



(۲۱)

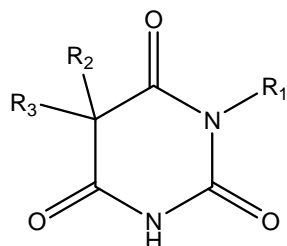
پیریمیدین‌ها برای اولین بار در سال ۱۸۸۹ میلادی توسط "گابریل" و "کولمن" شناسایی شده، این ترکیبات برای موجودات زنده بسیار مهم هستند. به عنوان مثال پورین‌ها، اوریک اسید و یک مخلوط ضد مالاریا و ضد باکتری شامل حلقه پیریمیدینی هستند. در مورد اهمیت پیریمیدین‌ها در طبیعت تحقیقات زیادی صورت گرفته است. در این مورد می‌توان به ویتامین B₁(۲۲)، اشاره نمود که اولین بار از سیبوس برنج استخراج شد [۷].



(۲۲)

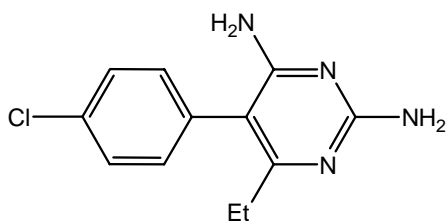
۵-۱-۱ کاربرد پیریمیدین‌ها:

باربیتورات‌ها (۲۳)، برای مدت طولانی، مهم‌ترین داروهای مسکن و خواب‌آور بوده‌اند. این ترکیبات ساختار پیریمیدینی دارند [۵].

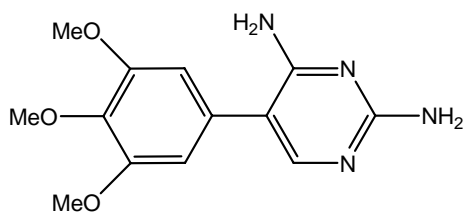

 $R_1 = \text{H, Me}$
 $R_2 = R_3 = \text{Alkyl}$

(۲۳)

پیریتامین (۲۴)، و تری‌متوپریم (۲۵)، عوامل ضد مالاریا هستند [۶].

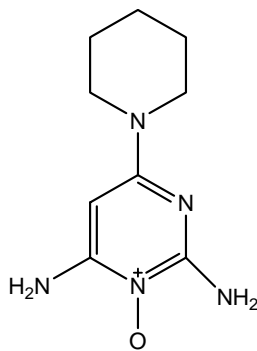


(۲۴)



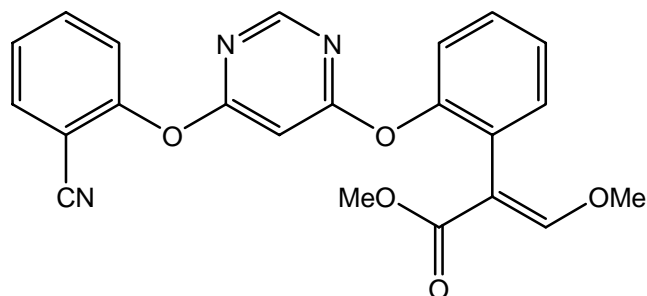
(۲۵)

مینوکسیدیل (۲۶)، یک گشادکننده عروقی است که در درمان افزایش فشارخون استفاده می-شود [۵].



(۲۶)

قارچ کش بتامتوکسی اکريلات (۲۷)، از پیریمیدین هاست [۵].

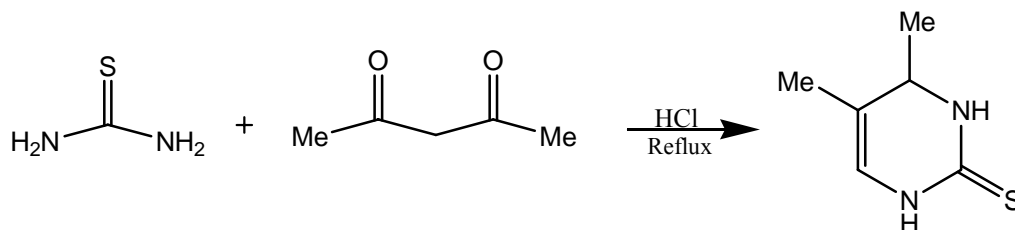


(۲۷)

۱-۱-۶ سنتز پیریمیدین‌ها: [۵]

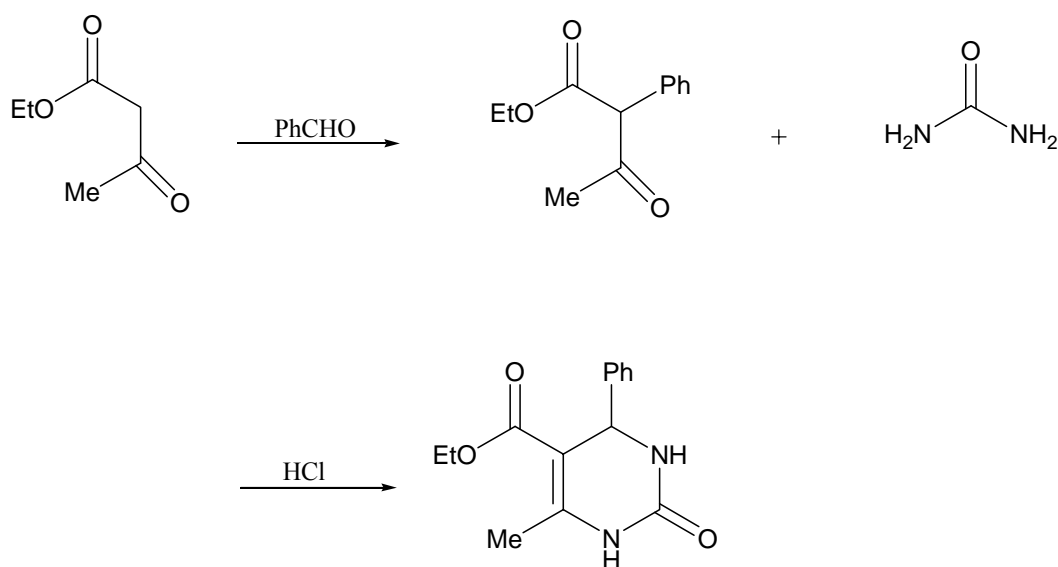
روشی که به طور معمول برای سنتز پیریمیدین‌ها به کار می‌رود، مستلزم ترکیب یک واکنشگر دارای واحد N-C-N با یک واکنشگر دارای واحد C-C-C است. هر دو نیتروژن واحد N-C-N هسته‌خواه و هر دو کربن موجود در دو طرف واحد به عنوان الکترون‌خواه عمل می‌کنند. اوره، تیوآوره و گوانیدین عموماً به عنوان واکنشگر N-C-N به کار برده می‌شوند. و کتون‌های α ، β -

غیراشباع یا مشتقات اسید نیز می‌توانند قطعه C-C-C را فراهم کنند. طرح (۱-۱)



طرح (۱-۱)

روشی که کاملاً با سنتز پیریمیدین‌ها مرتبط است، سنتز بیجینیلی دی‌هیدروپیریمیدین‌ها می‌باشد طرح (۱-۲). این واکنش در نوع مرسوم خود شامل تراکم سه‌جزئی β -کتواستر، یک آلدئید آروماتیک و آورده در حضور هیدروژن کلرید به عنوان کاتالیزور است.



طرح (۱-۲)

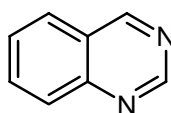
۷-۱-۱) کینازولین‌ها:

بیش از ۱۳۰ سال از سنتز نخستین مشتق کینازولین می‌گذرد [۸]، در این مدت کشف خواص متعدد کینازولین‌ها سبب توجه روز افزون به تهیه این ترکیبات شده است. بیشتر کینازولین‌های طبیعی از اجزای گیاهان جدا شده‌اند.

کاوش‌های زیادی که درباره خواص بیولوژیکی مشتقات کینازولینی انجام شده است، نشان می‌دهد این ترکیبات ضد مالاریا [۹]، انگل کش [۱۰]، باکتری کش [۱۱]، باز دارنده سرطان [۱۲]، تعدیل کننده قند خون [۱۳]، تنظیم کننده ضربان قلب، ضد سل، ضد تشنج، خواب آور، ضد تب، ضد تشنج و ضد فشارخون [۱۴] هستند.

۸-۱-۱) ساختار و واکنش پذیری کینازولین‌ها:

کینازولین (۲۸) از جوش دو حلقه پیریمیدین و بنزن حاصل می‌شود. از این رو گاهی آن را ۵،۶-بنزوپیریمیدین هم نامیده‌اند. این ترکیب دارای خصلت آروماتیکی می‌باشد. چنانچه یکی از حلقه‌ها احیاء شده باشد، به آن هیدروکینازولین گفته می‌شود.



(۲۸)

حلقه پیریمیدین در کینازولین‌ها متأثر از حضور حلقه بنزنی، واکنش‌پذیری متفاوتی از خود نشان می‌دهد به نحوی که دو اتم نیتروژن کینازولین دیگر هم ارز نیستند و در نتیجه واکنش‌های مختلف می‌تواند در موقعیت‌های مختلف این ترکیب انجام شود.