

путем с использованием метода ГХ-МС было установлено, что добавление 10% иодбензола сокращает время реакции до 8 часов, а также

приводит к уменьшению объема перекиси водорода и к увеличению выходов продуктов.

Список литературы

1. P. Maël, *Direct asymmetric aldol reaction cocatalyzed by L-proline and group 12 elements Lewis acids in the presence of water* // *Tetrahedron Letters*, 2011.– Vol.67.– P.159–162.
2. T. Hua, *Proline-based dipeptides as efficient organocatalysts for asymmetric aldol reactions in brine* // *Tetrahedron*, 2011.– Vol.67.– P.1074–1080.
3. C. Hardoin, M.J. Kelso, F.A. Romero, T.J. Rayl, D. Leung // *J.Med. Chem.*, 2007.– 50.– 5.3359.
4. P. Kraft, R. Cadalbert. *The Thia-Analog Of Ambrettolide. Synthesis and Odor of 1,8-oxathiacyclohexadecan-2-one* // *Synlett*, 1997.– №5.– P.600–602.
5. Г.И. Никишин, А.В. Александров, А.В. Игнатенко, Е.К. Старостина. *Синтез ω-галогеналифатических карбоновых кислот разложением циклоалкан гидропероксидов ионами меди* // *Известия АН СССР, Серия химическая*, 1984.– №11.– С.2628–2630.
6. Пат. 2404812 Российская Федерация, МПК8: C07C55/00 *Способ получения ω-иодалифатических карбоновых кислот и их эфиров* / Юсубов М.С., Жданкин В.В., Ларькина М.С., Дрыгунова Л.А.; заявитель и патентообладатель Сибирский государственный медицинский университет.– №2012136163/04.– заявл. 21.08.2012.– опубл. 27.09.2013.– Бюл. №27.

ИСПОЛЬЗОВАНИЕ НЕКОТОРЫХ ИОДСОДЕРЖАЩИХ ОРГАНИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ В КАЧЕСТВЕ ПРЕКУРСОРОВ ДЛЯ СИНТЕЗА РАДИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКИХ ПРЕПАРАТОВ

Е.В. Подрезова¹, В.В. Подрезов¹, М.С. Ларькина²
Научный руководитель – д.х.н., профессор М.С. Юсубов

¹Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, katerina.podrezova06@mail.ru

²Сибирский государственный медицинский университет
634050, Россия, г. Томск, Московский тракт 2

В связи с ежегодным ростом числа онкологических заболеваний, которые продолжают оставаться в списке лидеров причин смертности населения промышленно развитых стран, необходимо наличие препаратов, которые позволяют проводить диагностику на ранних этапах заболевания. В качестве таких препаратов выступают РФП (радиофармпрепараты).

Как известно, разработка и создание высокоэффективных РФП носит междисциплинарный характер, но основой всего является выбор радионуклидов с оптимальными ядерно-физическими характеристиками, а также введение в структуры биологически активных веществ лиганд с высокой хелатирующей способностью для прочного связывания с радионуклидом (радиоизотопом). Проанализировав существующие подходы к синтезу хелатных комплексов для

связывания с металлами, прочными, стабильными и устойчивыми являются комплексы, связанные с атомом азота, серы и кислорода [1].

Известно, что ДМСК (димеркаптосукциновая кислота, DMSA) часто используется в качестве РФП для лечения отравления токсическими тяжелыми металлами. В своем составе ДМСК содержит две карбоновые и две тиоловые группы, т.е. атом серы и кислорода (схема 1) [2].

Мы же в качестве хелатного центра, содержащего серу, выбрали сульфгидрильную группу, а именно 6-тиогексановую кислоту.

Для ее синтеза в качестве исходного субстрата был использован метил 6-иодгексаноат, полученный окислительным расщеплением циклогексанона (схема 2) [3].

Для получения 6-тиогексановой кислоты мы использовали метил 6-иодгексаноат и натрия

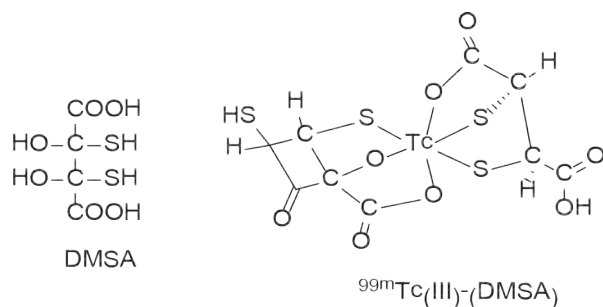


Схема 1. Структура ДМСК и $^{99m}\text{Tc(III)}$ – ДМСК

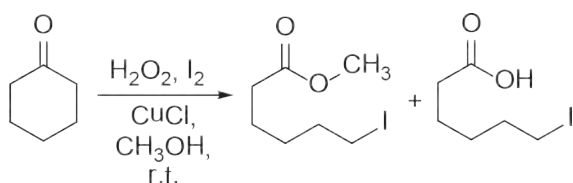


Схема 2. Получение метилового эфира ω -иодгексановой кислоты и ω -иодгексановой кислоты

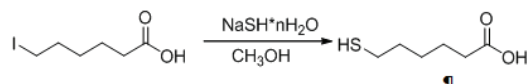


Схема 3. Получение 6-тиогексановой кислоты

гидросульфид. Подобранные условия позволили значительно снизить содержание побочного продукта – тиоэфира до 10%.

Следующей etapом было получение 6-тиогексановой кислоты. Для этой цели был использован метил 6-тиогексаноат. Гидролиз проводили в смеси ацетонитрил-вода. В данном случае происходит окисление эфира с образованием побочного продукта (дисульфида 40%).

Поэтому для получения 6-тиогексановой кислоты целесообразнее использовать 6-иодгексановую кислоту, действуя на нее натрия гидросульфидом (схема 3).

Таким образом, по данным ^1H -ЯМР-спектра в таких условиях образование побочного продукта – тиоэфира уменьшается (до 5%).

Список литературы

1. M.S. Ardestani, Novel and facile methods for the synthesis of DTPA-mono-amide: a new completely revised strategy in radiopharmaceutical chemistry // *J Radioanal Nucl Chem.*, 2010. – Vol.283. – P.447–455.
2. W. Kieviet, Technetium Radiopharmaceuticals: Chemical Characterization and Tissue Distribution of Tc-Glucoheptonate Using Tc-99m and Carrier Tc-99 // *J Nucl Med.*, 1981. – Vol.22. – P.703–709.
3. Пат. 2404812 РФ, МПК8:С07С55/00 Способ получения ω -иодалифатических карбоновых кислот и их эфиров / Юсубов М.С., Жданкин В.В., Ларькина М.С., Дрыгунова Л.А. – № 2012136163/04. – заявл. 21.08.2012. – опубл. 27.09.2013. – Бюл. №27.

ПОЛУЧЕНИЕ N-КАРБАМОИЛ-N'-БЕНЗГИДРИЛАМИНОКИСЛОТ

Е.А. Поспелова, В.Ю. Куксенюк

Научный руководитель – к.х.н., доцент В.В. Штрыкова

Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30, e.a.pospelova@mail.ru

Известно, что бензгидрилмочевины (БГМ) обладают выраженной противосудорожной активностью [1]. Наибольшую активность в ряду БГМ проявляет м-хлорБГМ (оригинальный препарат галодиф).

Одним из направлений по созданию новых лекарственных препаратов является создание структур, содержащих в своём составе фрагменты уже известных лекарственных средств. Наиболее интересными производными БГМ могут быть N-карбамоил-N'-бензгидриламинокислоты, содержащие в структуре остатки природных

α -аминокислот. Аминокислоты, как известно, обладают различной биологической активностью, адаптированы к человеческому организму и, кроме того, являются оптически активными соединениями. Поэтому включение их в структуру препарата может усилить его терапевтический эффект.

Нами была разработана схема синтеза N'-алкилированных производных N-карбамоиламинокислот (1-6), заключающаяся в получении соединений (1-6) реакцией взаимодействия соответствующих аминокислот с NaNCO и их