

4-хлор-7-бром-2,1,3-бензоксадиазола с некоторыми азолами.

Нами было найдено, что реакция 4-хлор-7-бром-2,1,3-бензоксадиазола (**6**) с имидазолом в условиях основного катализа протекает с образованием продукта кинезамещения – 4,6-диимидазол-2,1,3-бензоксадиазола (**3**), а не ипсо-замещения – 4,7-диимидазол-2,1,3-бензоксадиазола.

В тоже время взаимодействие соединения

6 с 1,2,4-триазолом приводит к образованию ожидаемого продукта реакции – 4,7-ди(1,2,4) триазолил-2,1,3-бензоксадиазола (**7**) и продукта кинезамещения – 4,6-ди(1,2,4) триазолил-2,1,3-бензоксадиазола (**5**).

Соединение **7** представляет особый интерес в качестве лиганда для получения координационных соединений, в связи с симметричностью молекулы и наличием ярко выраженных люминесцентных свойств.

Список литературы

1. Lee S.Y., Kim C., // *Inorg. Chem. Commun.*, 2017.– Vol.77.– P.6–10.
2. Amatori S. et.al. // *Inorg. Chem.*, 2014.– Vol.53.– 4560–4569.
3. Song Ch. et.al. *Dalton Trans.*, 2016.– 45.– 190–197.

ВВЕДЕНИЕ ФАРМАКОФОРНЫХ ФРАГМЕНТОВ В БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ФОСФОРИЛУКСУСНЫЕ КИСЛОТЫ

И.А. Крутов¹, А.А. Валиева¹, С.С. Корнилов¹, Д.О. Никитин², А.В. Плотникова²
 Научный руководитель – д.х.н., профессор Е.Л. Гаврилова

¹Казанский национальный исследовательский технологический университет
 420015, Татарстан, г. Казань, ул.К.Маркса 68, cat_the_chemist@mail.ru

²Казанский государственный медицинский университет Минздрава России
 420012, Татарстан, г. Казань, ул. Бутлерова 49

Модификация фармакофорными фрагментами соединений известных как биологически активные препараты – один из способов к созданию новых лекарственных средств. Гидразиды фосфорилированных карбоновых кислот известны как соединения проявляющие нейротропную активность [1]. Наиболее изучена нейротропная активность препаратов Фосеназид **1** (гидразид дифенилфосфорилуксусной кислоты) и КАПАХ **2** (2-[4-(диметиламино)фенил]-(2-хлорэтокси)

фосфорилацетгидразид).

С целью изучения фармакологического профиля новых производных фосфорилуксусных кислот, нами предлагается: 1 направление – модификация **1** тиосемикарбазидным и триазольным фрагментами, биологическая активность которых широко известна [2, 3]; 2 направление – модификация (2-этокси)-2-оксоэтил)арилфосфиновых кислот **3 а-в**, структурных аналогов препарата КАПАХ **2**, с помощью фрагментов

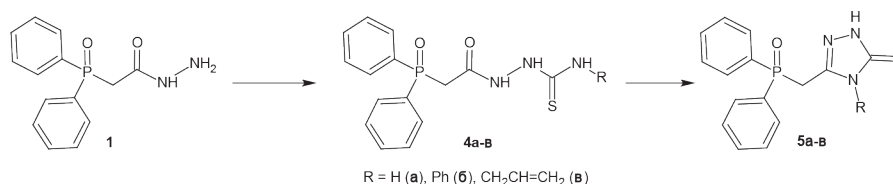


Схема 1.

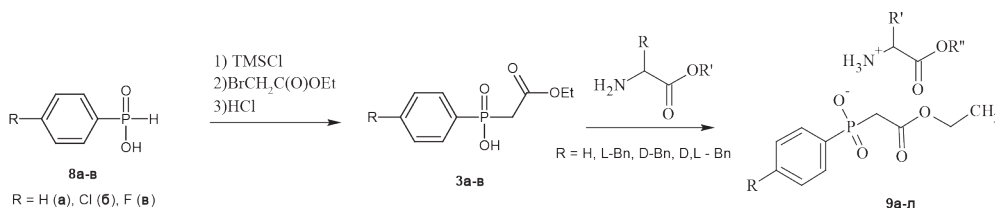


Схема 2.

α -аминокислот с целью получения N-замещенных аммониевых солей. В литературе приводятся данные, что соли КАПАХа обладают нейротропной активностью [4, 5].

С целью реализации 1-го направления, из гидразида **1** получены различные тиосемикарбазиды **4 а–в**, последние переведены в соответствующие 1,2,4-триазол-3-тионы **5 а–в** кипячением в водном растворе NaOH (схема 1). Триазолтионы **5** содержат в составе гетероцикла два нуклеофильных центра: экзоциклический атом серы и эндоциклический атом азота [6], что позволяет планировать дальнейшую S,N-модификацию различными электрофильными реагентами.

В рамках 2-го направления, из соответствую-

ющих арилфосфиновых кислот **8 а–в** был синтезирован ряд (2-этокси)-2-оксоэтил)арилфосфиновых кислот **3 а–в**, которые далее вовлекались во взаимодействие с эфирами α -аминокислот с образованием соответствующих солей **9 а–л** (схема 2).

Структура всех синтезированных соединений исследована комплексом физико-химических методов, состав подтвержден данными элементного анализа. Некоторые из полученных соединений исследовались на фармакологическую активность в КГМУ.

Работа выполнена при финансовой поддержке РФФ, проект № 14-23-00073-п.

Список литературы

1. Тарасова Р.И., Москва В.В. // *ЖОХ.*, 1997.– Т.67.– №9.– С.1483–1496.
2. Ş.G. Küçüküzünel, P. Çikla-Süzgün. // *European Journal of Medicinal Chemistry*, 2015.– V.97.– №5.– P.830–870.
3. Shailey Singhal at al. // *World journal of pharmacy and pharmaceutical sciences*, 2013.– V.2.– №6.– P.4661–4681.
4. Макарова Е.А. Дисс. ... Канд. биол. наук. Казанский Государственный медицинский университет, Казань, 2015.– 141.
5. Тарасова Р.И., Воскресенская О.В., Семина И.И., Москва В.В. // *ЖОХ*, 1998.– Т.68.– №8.– 1275–1280.
6. Rzhetskii A.A. at al. // *Russ. Chem. Bull.*, 2012.– V.61.– №11.– P.2133–2136.

РЕГИОСЕЛЕКТИВНЫЙ МЕТОД АЗИД-АЛКИНОВОГО ЦИКЛОПРИСОЕДИНЕНИЯ В ПРИСУТСТВИИ Zn(OAc)₂ В ВОДЕ

А.К. Куанышева, М.А. Морозова
Научный руководитель – д.х.н., доцент М.Е. Трусова

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

1,4-дизамещенные-1,2,3-триазолы являются важным классом гетероциклических соединений, имеющие широкое применение в органиче-

ской химии, материаловедении, медицины [1]. Одним из путей синтеза замещенных триазолов является взаимодействие азидов с алкинами в

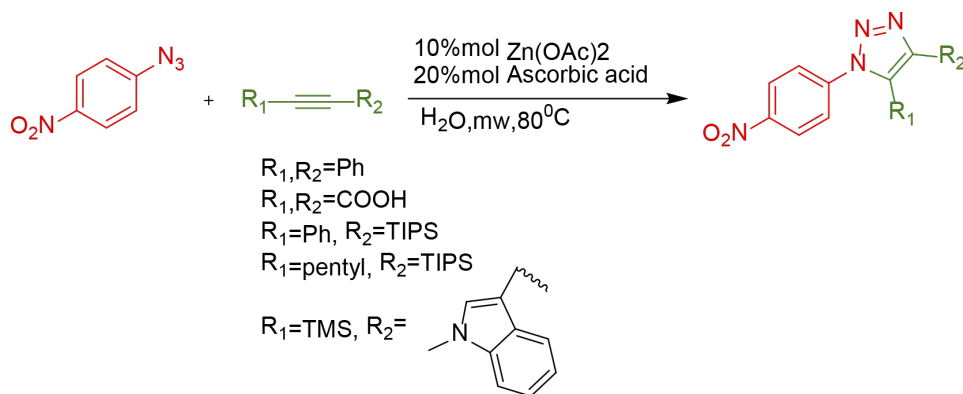


Схема 1.