

Схема 1.

реагентом для введения фармакофорной группировки послужил 4-аминоантипирин 2.

На основе реакции Манниха (где гликолурил 1 использовался в качестве соединения, имеющего подвижные атомы водорода) нами было успешно синтезировано новое тетрациклическое производное 3 с антипириновыми фрагментами. Отметим высокую эффективность и простоту реализации подобного подхода – реакция проводилась в мягких условиях, а выход целевого продукта составил более 80%.

Строение нового полученного соединения 3 было установлено с использованием современных физико-химических методов анализа: ЯМР

(¹H и ¹³C), ИК-спектроскопии. Литературные сведения о свойствах вещества 3 не найдены.

Для сравнения уточним, что ранее подобным методом исследователями были получены тетрациклические системы с включением других аминоксодержащих фрагментов [3], однако, в более жестких реакционных условиях и с меньшими выходами.

Резюмируя, отметим, что взаимодействие гликолурила 1 с формальдегидом и 4-аминоантипирином 2 в простых условиях привело к образованию нового тетрациклического продукта 3 – структуры-кандидата БАВ.

Список литературы

1. Kravchenko A.N., Baranov V.V., Gazieva G.A. // *Russ. Chem. Rev.*, 2018.– Vol.87.– №1.– P.89–108.
2. Stancl M., Hodan M., Sindelar V. // *Organic Letters*, 2009.– Vol.11.– №18.– P.4184–4187.
3. Салькеева Л.К., Шибеева А.К., Бакибаев А.А., Тайшибекова Е.К., Минаева Е.В., Жортарова А.А., Салькеева А.К. // *Журн. общ. хим.*, 2014.– Т.84.– №2.– С.344–345.

СИНТЕТИЧЕСКИЕ ПУТИ ПОВЫШЕНИЯ ЭФФЕКТИВНОСТИ БАВ

А.Е. Малмакова¹, П. Даулетбай¹, О. Ахметсадык², С. Танабаева², П. Бұрханова², А. Дулатбаев²
 Научный руководитель – д.х.н., профессор, главный научный сотрудник В.К. Ю^{1,2}

¹АО «Институт химических наук им. А.Б. Бектурова»
 050010, Казахстан, Алматы, Ш. Уалиханова 106

²Казахстанско-Британский технический университет 050000,
 Казахстан, Алматы, ул. Толе-би 59, a.malmaqova@mail.ru

Не секрет, что в обществе существует отрицательное отношение к химии как отрасли промышленности, дающей высокий вклад в загрязнение окружающей среды, и представляющей повышенную опасность. С другой стороны, химия способна и создает новые реагенты, препараты, катализаторы и разнообразные материалы, необходимые для человека. Развитию современной химии характерна тенденция ужесточения экологических норм и переход на безопасные и

эффективные материалы и технологии.

Основным научным направлением наших исследований является синтетический поиск новых биологически активных препаратов в ряду азагетероциклов. Среди синтезированных веществ обнаружены средства для обезболивания, купирования сердечных аритмий, иммунокорректоры, ингибиторы роста болезнетворных микроорганизмов, геропротекторы, стимуляторы роста растений и др. [1–3]. Для пролонгирования

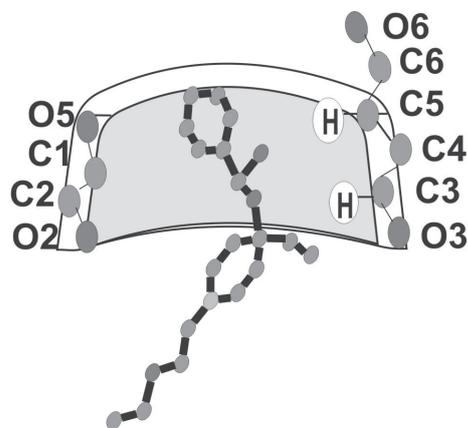


Схема 1.

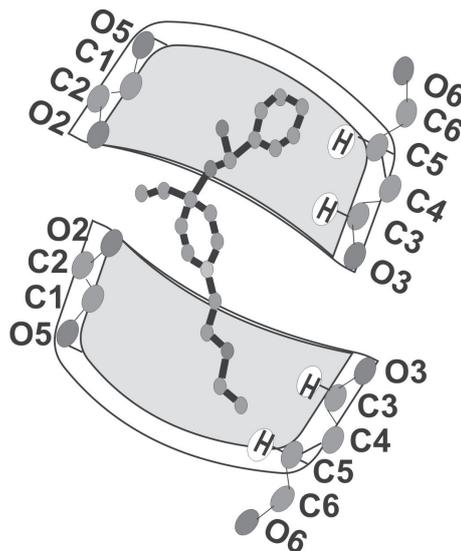


Схема 2.

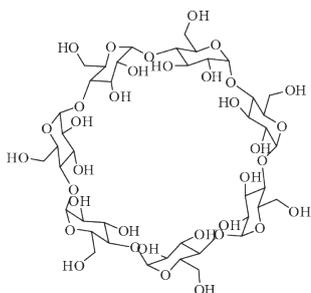


Схема 3.

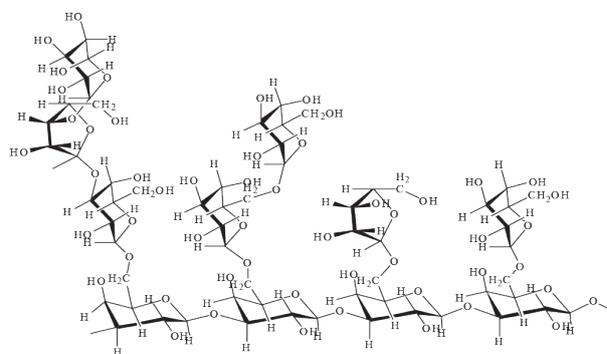


Схема 4.

биологического действия получены комплексы включения 1-(2-этоксиэтил)-4-этинил-4-бензоилоксипиперидина (казкаин) с β -циклодекстрином (β -ЦД). Показано, что Казкаин-гидрохлорид образует 1:1 ассоциаты β -ЦД, в которых молекула казкаина включается во внутреннюю полость молекулы β -ЦД бензоильным заместителем. В случае казкаин-основания формируются ассоциаты состава 2 : 1, в которых молекула казкаина располагается во внутренних полостях двух молекул β -ЦД, с одной стороны бензоильным и с другой этоксиэтильным заместителями [4]. Как и ожидалось, включение казкаина в β -ЦД привело к пролонгированию местноанестезирующего действия, снижение токсичности и появление анальгетической активности у комплекса с казкаином основанием.

В продолжение описанных НИР основной идеей настоящего сообщения является поиск путей повышения эффективности действия (усиление активности, пролонгирование, снижение токсичности и др.) биологически активных ве-

ществ (казкаина и стимулятора роста растений Каз-6) пиперидинового ряда и применяемых лекарственных препаратов (димедрола и толперизона) иммобилизацией их β -ЦД и арабиногалактан. Изучаемые объекты (БАВ) относятся к достаточно сложным по структуре органическим азагетероциклам, обладающим биологической активностью, но не лишенных недостатков. Для достижения намеченной цели синтезированы ассоциаты БАВ как в виде гидрохлоридов, так и оснований, с β -ЦД и арабиногалактаном в соотношении БАВ : полимер = 1 : 1 и 1 : 2. Оказалось, что ассоциаты БАВ-основание с арабиногалактаном представляют из себя жидкости. Образование ассоциатов контролировалось методами ИК спектроскопии и рентгенофазового анализа.

Подготовлены образцы для оценки биоэффективности ассоциатов.

Работа выполнена при финансовой поддержке МОН Республики Казахстан, грант №AP05131486/ГФ5.

Список литературы

1. Yu V.K., Nagimova A.D., Praliev K.D., Shin S.N. and De Kimpe N. // *Pharm. Chem. J.*, 2002.– Vol.36.– P.382–384.
2. Kabdraisova A.Zh., Faskhutdinov M.F., Yu V.K., Praliev K.D., Fomicheva E.E., Shin S.N. and Berlin K.D. // *Chem. Nat.Compnd.*, 2007.– Vol.43.– P.437–440.
3. Yu V.K., Kabdraisova A.Zh., Praliyev K.D., Shin S.N. and Berlin K.D. // *J. of Saudi Chem. Soc.*, 2009.– Vol.13.– P.209–217.
4. Kemelbekov U.S., Hagenbach A., Lentz D., Imachova Sh.O., Pichkhadze G.M., Rustembekov Zh.I., Beketov K.M., Praliev K.D., Gabdulkhakov A., Guskov A., Saenger W. // *J. Incl. Phenom. Macrocycl. Chem.*, 2010.– 68:323–330.– DOI 10.1007/s10847-010-9791-7.– P.323–330.

ВЫСОКОТЕМПЕРАТУРНЫЙ СИНТЕЗ ДИ(1,2,4-ТРИАЗОЛ-1-ИЛ)АДАМАНТАНА

Р.Д. Марченко

Научный руководитель – д.х.н., инженер-исследователь НОЦ имени Кижнера А.С. Потапов

Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, Россия, г. Томск, пр. Ленина 30

Соединения, включающие азольный цикл, используются в медицине, биохимии, аналитической и координационной химии. Возможность получения координационных полимеров на основе азолов позволяет использовать их в процессах разделения и хранения газов, очистки (в том числе селективной) от ионов металлов, в катализе.

Большой интерес для координационной химии представляют бидентантные лиганды на основе азолов благодаря их способности образовывать двух- и трехмерные полимерные координационные соединения. Одним из перспективных строительных блоков является

1,3-бис(1,2,4-триазолил)адамантан. Украинская группа исследователей совместно с немецкими коллегами предложила синтез бис(1,2,4-триазол-4-ил)адамантана из 1,3-диаминоадамантана и диметилформаид азина в кипящем ксилоле с *p*-толуолсульфокислотой в качестве катализатора [1]. Группа китайских авторов синтезировала бис(1,2,4-триазол-1-ил)адамантан путём растирания адамантана и 1,2,4-триазола в присутствии бромида алюминия и тетрабромметана [2]. Однако данная реакция сопряжена с определённым риском при использовании токсичного и высоко реакционноспособного агента – бромида алюминия. Нами был предложен ранее

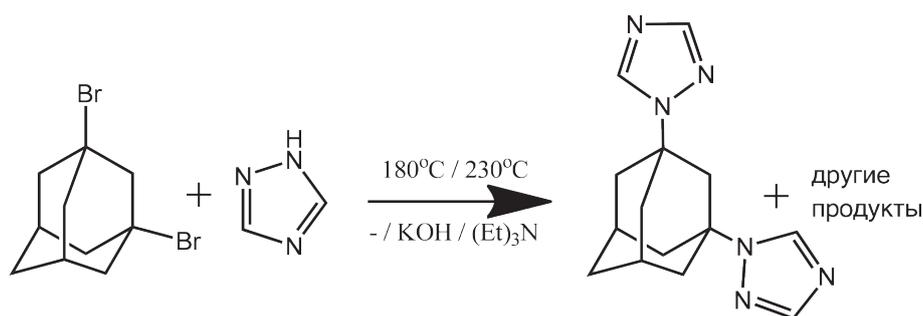


Схема 1.

Таблица 1.

Температура	180°C	230°C
Без основания	БТАА	БТАА (33%)
С гидроксидом калия	БТАА + 1-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-4-ил)адамантан + следы 1-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)адамантана	БТАА + 1-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-1-ил)адамантан + 1-гидрокси-3-(1,2,4-триазол-4-ил)адамантан (55%)
С триэтиламином	БТАА + 1,3-бис(1,2,4-триазол-4-ил)адамантан	БТАА + большое количество побочных продуктов (119%)