

**Схема 3.** Синтез 1,3-оксазолов из 2-тиозамещённых 2-ен-4-иналей

лидинам с хорошими выходами (схема 2). При взаимодействии наших объектов с п-тозилметиллизотиоцианидом получены оксазолы (схема 3).

Таким образом, получены неизвестные ранее 2-тиозамещённые 2-ен-4-инали. Показано, что исследованные нами нуклеофилы реагируют с ениналями хемоселективно по карбонильной группе.

### Список литературы

1. Buser D., Pauling H., Thum A., Bonrath W // *Molecules*, 2002. – Vol. 7. – №3. – P. 341.
2. Haugan J.A., Lobkovsky E., Liaaen-Jensen S // *Acta Chem. Scand.*, 1997. – P. 1201.
3. Jima J., Akumik H.I., Itatankia A., Ada Z., Jiri E.M., Akada T. // *Canad. J. Chem.*, 1985. – Vol. 63. – P. 2885.

Основные результаты получены на оборудовании Байкальского аналитического центра коллектива с использованием СО РАН.

Исследование выполнено при финансовой поддержке РФФИ и Правительства Иркутской области в рамках научного проекта (№20-33-90022).

## ИЗУЧЕНИЕ РЕАКЦИИ ПЕРЕЭТЕРИФИКАЦИИ 7-НИТРО-2-ОКСО-5-ФЕНИЛ-2,3-ДИГИДРО-1Н- БЕНЗО[Е][1,4]ДИАЗЕПИН-3-ИЛ АЦЕТАТА

Г.А. Фролов<sup>1,2</sup>, К.А. Леонов<sup>2</sup>, О.В. Иванова<sup>1</sup>

Научный руководитель – д.х.н., профессор НОЦ Н.М. Кижнера Томского политехнического университета В.И. Павловский

<sup>1</sup>Томский государственный университет

634050, Россия, г. Томск, ул. А. Иванова, 49, frolov2002@gmail.com

<sup>2</sup>ООО «ИФАР»

634021, Россия, Томская обл., Томск, ул. Елизаровых, 79/4

Производные 1,4-бензодиазепина нашли широкое применение в медицинской практике после того, как в 60-е годы XX столетия были обнаружены их психотропные свойства. В настоящее время применяется более 50 субстанций на основе 1,4-бензодиазепина.

Основное применение производных 1,4-бензодиазепина – противосудорожное, снотворное, миорелаксантное и седативное действие.

Также производные 1,4-бензодиазепина изучались как лиганды холецистокининовых и брадикининовых рецепторов.

На основе производного 1,4-бензодиазепина фирмой ООО «ИФАР» был разработан высокоэффективный анальгетик PAV-0056 [1], который является антагонистом брадикининовых рецепторов и не имеет аффинитета к центральным бензодиазепиновым рецепторам и TSPO рецепторам (периферические бензодиазепиновые рецепторы).

На рисунке 1 приведена принципиальная схема синтеза PAV-0056.

Нашей задачей было усовершенствование условий реакции переэтерификации (синтез соединения PAV-0022), поскольку по предложенной ранее методике выход целевого продукта составляет 60% и всегда загрязнен исходными веществом PAV-0019 от 3% до 5%.

Нами были изучены различные системы растворителей для данной реакции. В результате удалось повысить выход целевого продукта до 90% и содержания примеси PAV-0019 не более 0,3%.

Контроль за ходом реакции и чистотой продуктов осуществлялся методом ВЭЖХ на приборе «Shimadzu».

Исследование выполнено на предприятии ООО «ИФАР».

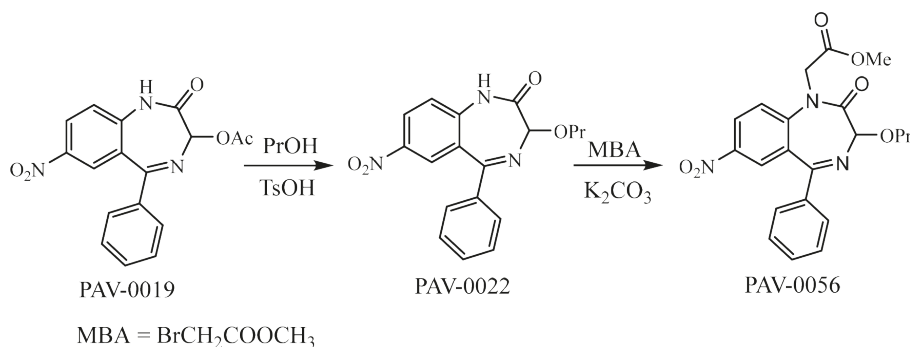


Рис. 1. Схема синтеза PAV-0056

## Список литературы

1. Пат. РФ №2701557, 2017.

# СИНТЕЗ, ГИДРОЛИЗ И ПРОТИВОВИРУСНАЯ АКТИВНОСТЬ АЛКАЛОИДОПОДОБНЫХ АННЕЛИРОВАННЫХ ПИРАНО[4,3-*b*]ПИРРОЛОВ

Е.Е. Храмова

Научный руководитель – д.х.н., профессор, заведующий кафедрой органической химии ПГНИУ А.Н. Масливец

Пермский государственный национальный исследовательский университет  
614990, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, д. 15, caterina.stepanova@yandex.ru

2020 год стал переломным для всего человечества. Пандемия COVID-19 продемонстрировала, насколько мы беззащитны перед вирусными заболеваниями, и что наш арсенал противовирусных препаратов недостаточен.

Амариллисовые алкалоиды проявляют множество разнообразных видов биологической активности [1]. Для разработки противовирусных средств наибольший интерес представляет претацеттин, поскольку было обнаружено, что он обладает выраженной противовирусной активностью по отношению к онкогенным вирусам (вирус лейкоза Раушера), флавивирусам (вирус японского энцефалита, вирус желтой лихорадки, вирус лихорадки денге), буньявирусам (вирусы лихорадок Пунта-Торо и Рифт-Валли), а также вирусу простого герпеса первого типа [1].

В основе структуры претацеттина лежит пентациклический 5/6/6/5/6-ангулярный каркас, содержащий пирано[2,3-*c*]пиррол (рис. 1).

Недавно взаимодействием гетарено[*e*]пиррол-2,3-диононов **1** с алкенами **2** в нашей лаборатории были получены аналоги претацеттина – 6/6/5/6-ангулярно аннелированные пирано[4,3-*b*]пирролы **3** (схема 1), интересной особенностью химической структуры которых являлось наличие лабильного 3,4-диги-

дро-2*H*-пиранового фрагмента, как и в структуре претацеттина (рис. 1) [2–5].

В ФБУН ГНЦ ВБ «Вектор» Роспотребнадзора были изучены противовирусная (вирус осповакцины (штамм Копенгаген)) и цитотоксическая (клетки Vero) активности ряда соединений **3**. Было установлено, что некоторые представители соединений **3** обладают противовирусным действием превышающим таковое препарата сравнения – Цидофовира [6].

В результате исследования гидролиза соединений **3** (X=O) (в том числе в условиях исследования противовирусной активности) было установлено, что в зависимости от заместителя R<sup>2</sup>, гидролиз соединений **3** протекает либо с преимущественным образованием соединений **4**, либо соединений **5** (схема 2).

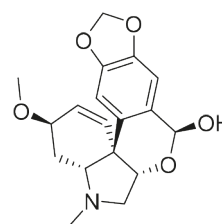


Рис. 1. Претацеттин