

Схема 1.

акции переаминирования мочевины.

Нами показано, что при взаимодействии 4-аминоантипирина 1 с мочевиной 2a или 2b в условиях сплавления происходит образование соответствующих N-антипирилмочевин 3a или 3b соответственно.

Строение синтезированных антипирилмочевин 3a и 3b было доказано с использованием методов ИК-, ЯМР (¹H и ¹³C), а для соединения 3a – сравнением значений T_{пл} с литературными

данными [3]. Отметим, что свойства 1,3-дизамещенной мочевины 3b не найдены в литературе.

Таким образом, реакцией переаминирования получены мочевины с фармакофорным антипиринным фрагментом. На основе взаимодействия 4-аминоантипирина 1 и галодифа 2b синтезировано новое соединение 3b, перспективное для исследования его биологической активности.

Список литературы

1. Бакибаев А.А., Мамаева Е.А., Яновский В.А., Быстрицкий Е.Л., Яговкин А.Ю. *Препаративные методы синтеза азотсодержащих соединений на основе мочевины.* – Томск: Аграф-Пресс, 2007. – 164с.
2. Новожеева Т.П., Горшкова В.К., Смагина М.И., Фатеева С.Н., Алугшвили З.З., Олейник Н.Б., Ахмеджанов Р.Р. // *Бюллетень сибирской медицины*, 2006. – Прил.2. – С.41–43.
3. Takahashi T., Hori M., Kanematsu K. // *Yakugaku Zasshi*, 1956. – Vol.76. – P.568–570.

ЭФФЕКТИВНЫЙ СИНТЕЗ НОВОГО ТЕТРАЦИКЛИЧЕСКОГО СОЕДИНЕНИЯ НА ОСНОВЕ ГЛИКОЛУРИЛА

А.В. Леппа

Научный руководитель – к.х.н., ассистент Е.А. Мамаева

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

Интерес исследователей к бисмочевинам бициклооктанового ряда (гликолурилам) основывается на их широком применении в различных отраслях промышленности. Эти соединения известны своими антибактериальными, ноотропными, нейротропными и др. полезными свойствами [1]. Одним из направлений химии гликолурилов является исследование их химических и супрамолекулярных свойств [2].

Антипиринный фрагмент является фармакофорным элементом, придающим биологическую активность органическим соединениям. Так, структура антипирина является ключевой

для известных лекарственных препаратов: феназона, анальгина, амидопирина, йодантипирина.

В связи с этим, продолжение изучения химических свойств гликолурилов и получение на их основе новых структур с включением известных фармакофорных центров, в том числе антипиринного, можно отнести к реализации одного из традиционных принципов скрининга, и по настоящее время применяемых при создании новых БАВ.

В качестве объекта для изучения химических свойств был выбран 2,4,6,8-тетраазабицикло[3.3.0]октан-3,7-дион 1 (гликолурил), а

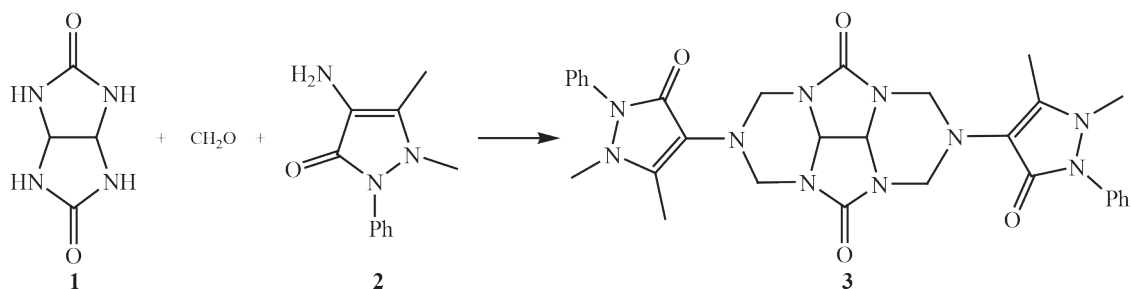


Схема 1.

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.malimakova@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