

ческий потенциал пиридилкамфоросульфонов (16–66) для функционализации соединений пиридинового строения.

Таким образом, мы предлагаем эффективный, экологически безопасный метод синтеза ранее неизвестных пиридилкамфоросульфо-

нов. Обнаруженная высокая реакционная способность пиридилкамфоросульфонов в реакции S_N делает их ценными полупродуктами для получения высоко функционализированных соединений пиридинового скелета.

Список литературы

1. Hammoud H., Schmitt M., Bihel F., Antheaume C., Bourguignon J.-J. // *J. Org. Chem.*, 2012.– 77.– 1.– P.417–423.
2. Pschierer J., Plenio H. // *Eur. J. Org. Chem.*, 2010.– 29.– P.2934–2937.
3. Tretyakov A.N., Krasnokutskaya E.A., Gorlushko D.A., Ogorodnikov V.D., Filimonov V.D. // *Tetrahedron Letters*, 2011.– 52.– 1.– P.85–87.
4. Krasnokutskaya E.A., Kasanova A.Zh., Estaeva M.T., Filimonov V.D. // *Tetrahedron Lett.*, 2014.– 55.– P.3771–3773.
5. Kasanova A.Zh., Krasnokutskaya E.A., Beisembei P.S., Filimonov V.D. // *Synthesis*, 2016.– 48.– 2.– P.256–262.
6. Han W., Jin F., Zhao Q., Du H., Yao L. // *Synlett*, 2016.– 27.– 12.– P.1854–1859.
7. Hosseini A., Khalilzadeh M.A., Hosseinzadeh M., Tajbakhsh M. // 2012.– 143.– 4.– P.619–623.

СИНТЕЗ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ПИПЕРИДИНА 3,7-ДИАЗАБИЦИКЛО[3.3.1]НОНАНОВОГО РЯДА

Э. Саутпаева¹, Г. Далжанова², А.Е. Малмакова²
Научный руководитель – д.х.н., академик НАН РК, профессор К.Д. Пралиев²

¹Казахстанско-Британский технический университет
050000, Казахстан, Алматы, ул. Толе-би 59

²АО «Институт химических наук им. А.Б. Бектурова»
050010, Казахстан, Алматы, Ш. Уалиханова 106, malmakova@mail.ru

Одним из главенствующих направлений тонкого органического синтеза является поиск и создание новых синтетических заменителей лекарственных средств растительного происхождения для нужд медицины нашей страны. Ряд 3,7-диазабицикло[3.3.1]нонанных производных может рассматриваться как перспективный класс соединений для конструирования новых биологически активных веществ благодаря достаточно большому количеству центров, в которые могут вводиться заместители, и жесткому каркасу, обеспечивающему их пространственное расположение, необходимое для оптимального взаимодействия с рецепторами за счет водородных связей, электростатических взаимодействий и других факторов. Широкий спектр фармакологического действия 3,7-диазабицикло[3.3.1]нонанных служит весомым аргументом для продолжения синтетического моделирования новых производных этого класса с потенциальной активностью.

С целью изучения физико-химических, спектральных, биологических свойств и уста-

новления зависимости между химическим строением и фармакологической активностью синтезированы новые синтоны потенциально фармакологически активных биспидинов с метоксипропильным и гетероциклическими заместителями.

Основным полупродуктом взят 1-(3-метоксипропил)-4-оксопиперидин (1), синтезированный последовательной цепочкой превращений: присоединение 2 молей метилакрилата по первичной аминогруппе 3-метоксипропиламина, циклизация образовавшегося диэфира по Дикману, одновременный гидролиз и декарбоксилирование 3-карбметоксипиперидона-4 с образованием целевого пиперидона-4.

Одновременной конденсацией аминокетона (1) с параформом и первичным амином, в уксусно-метанольной среде синтезирован новый 3,7-диазабицикло[3.3.1]нонан-9-он (2). Восстановление биспидона (2) в условиях реакции Кижнера-Вольфа действием гидразингидрата в триэтиленгликоле в присутствии КОН приводит к соответствующему 3,7-диазабициклононану

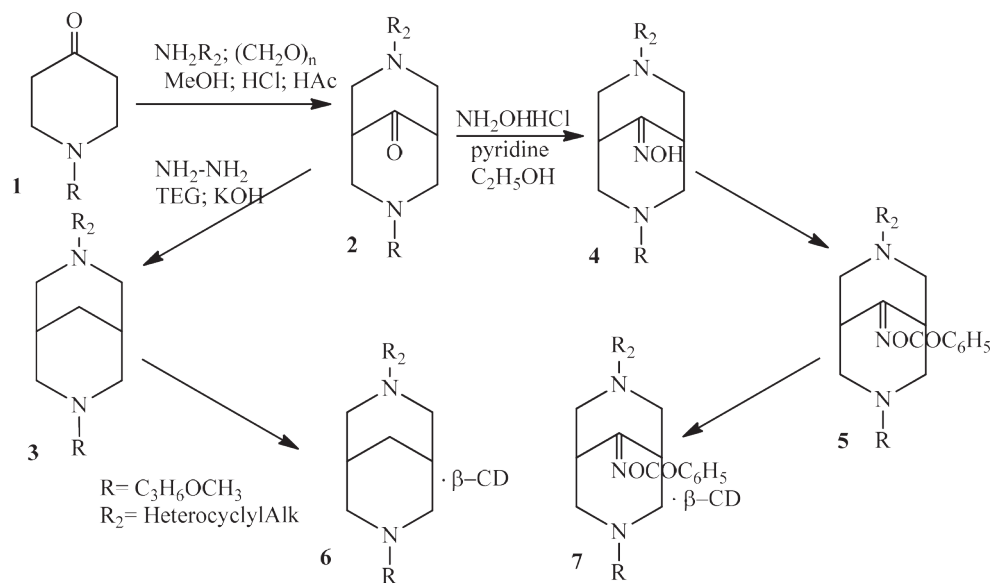


Схема 1.

(3) как потенциально биологически активное вещество.

Для получения потенциального анальгетика ненаркотического действия осуществлено взаимодействие 3,7-дизабицикло[3.3.1]нонан-9-она (2) с солянокислым гидросиламином в присутствии пиридина в этаноле. Ацилированием полученного оксима (4) хлористым бензоилом в абсолютном бензоле с последующей обработкой полученного гидрохлорида поташом получен соответствующий О-бензоилоксим (5).

Выделяют новые биспидиновые производные (2–5) с помощью колоночной хроматогра-

фии на окиси алюминия. Продукты превращений представляют собой вязкие масла. Строение синтезированных соединений (2–5) установлено на основании данных спектроскопии ЯМР и ИКС.

Поскольку синтезированные биспидины (2–5) представляют собой вязкие маслообразные вещества, для исследования их фармакологических свойств получены их твердые комплексы с β -циклодекстрином (β -CD) (6, 7).

Работа выполнена при финансовой поддержке МОН Республики Казахстан, в рамках ПЦФ BR05234667.

Список литературы

1. Malmakova A.Ye., Praliyev K.D., Welch J.T., Iskakova T.K., Ibraeva S.S. // *Eurasian Chemical-Technological Journal*, 2014. – Vol.6. – №1. – P.85–89.
2. Пат. к полезной модели №1987 // Пралиев К.Д., Пичхадзе Г.М., Искакова Т.К. Малмакова А.Е., Раимкулова К.Б., Кадырова Д.М., Смагулова Г.С., Исмагулова А.Ж.; опубл. 30.01.2017, Бюл. – №2. – 5с.
3. Пат. к полезной модели №1988 // Пралиев К.Д., Пичхадзе Г.М., Искакова Т.К. Малмакова А.Е., Раимкулова К.Б., Кадырова Д.М., Смагулова Г.С., Исмагулова А.Ж.; опубл. 30.01.2017, Бюл. – №2. – 25с.