

Полученные результаты подтверждают имеющиеся данные о том, что в данной реакции нуклеофил преимущественно замещается в то кольцо, которое обладает меньшей электронной плотностью. При этом образуются пара-замещенные в бензольном кольце гликозиды. Исследования в данной области в дальнейшем могут

помочь синтезировать гликозиды, которые невозможно получить гликозилированием, а также вводить в углеводные молекулы радиоактивные изотопы в одну стадию для создания радиофармпрепаратов.

Работа выполнена при поддержке гранта РФФИ №21-73-10211.

Список литературы

1. K. Aradi, Z. Novák. *Synthesis & Catalysis*, 2018. – V. 357. – P. 371–376.
2. Viktor V. Zhdankin and Peter J. Stang. *Chemical Review*, 2002. – V. 102 (7). – P. 2523–2584.
3. M. He, T. M. Swager. *Chemistry of materials*, 2016. – V. 28. – P. 8542–8549.

АЦИЛИРОВАНИЕ ГАЛОДИФА АНГИДРИДОМ О,О'-ДИАЦЕТИЛВИННОЙ КИСЛОТЫ

Н. А. Беляева, В. Ю. Куксёнок

Научный руководитель – к.х.н., старший преподаватель В. Ю. Куксёнок

Национальный исследовательский Томский политехнический университет
634050, г. Томск, пр. Ленина, 30, pab30@tpu.ru

Антиконвульсант Галодиф представляет собой нециклическое производное мочевины (1-[(3-хлорфенил)(фенил)метил] мочевины). В отличие от предшественников, он сам является действующим веществом, не требующим трансформации в печени [1]. Препарат обладает широким спектром противосудорожного действия. Препарат имеет малую токсичность и хорошую переносимость, не вызывает осложнений [2].

В составе молекулы Галодифа содержится хиральный атом углерода, таким образом, данное соединение существует в виде двух оптических изомеров. Однако в настоящее время Галодиф производится в виде рацемата. Рацематы могут отличаться по биологической активности от индивидуальных энантиомеров [3]. Поэтому поиск способов энантиомерного разделения ра-

цемического Галодифа, а также методов анализа его энантиомерного состава является актуальной задачей современной органической химии.

Целью настоящей работы была разработка метода синтеза уреида галодифа с L-(+)-O,O'-диацетилвинной кислотой, а также разделение и исследование его индивидуальных диастереомерных форм.

Замещённые мочевины проявляют низкую активность в реакциях ацилирования, поэтому нами был проведён подбор условий и ацилирующего агента, позволяющих получить целевой уреид. В результате исследования было обнаружено, что наиболее подходящим способом является ацилирование галодифа ангидридом (+)-O,O'-диацетилвинной кислоты в толуоле в присутствии серной кислоты (рис. 1).

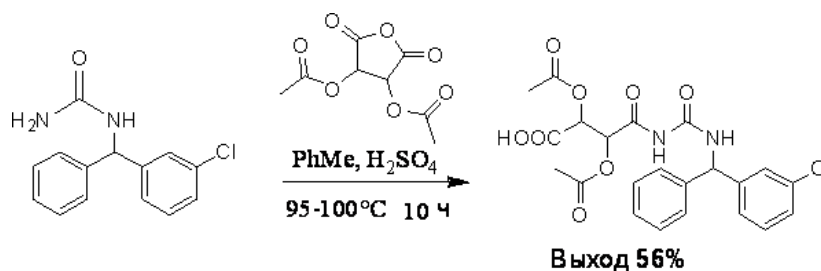


Рис. 1. Ацилирование галодифа ангидридом O,O'-диацетилвинной кислоты в присутствии серной кислоты

Таким образом, в настоящей работе впервые получено диастереомерное ацильное производное галодифа с оптически активной О,О'-диаце-

тилвинной кислотой. Структура продукта была подтверждена методами ЯМР, ИК-спектроскопии.

Список литературы

1. Filimonov V. D., Bakibaev A. A., Pustovoitov A. V., Tignibidina L. G., Pechenkin A. G., et al. // *Pharm. Chem. J.*, 1993. – Vol. 22 (5). – P. 358–363.
2. Новожеева Т. П., Горшкова В. К., Смагина М. И., Фатеева С. Н., Алугишвили З. З., Олейник Н. Б., Ахмеджанов Р. Р. // *Бюлл. Сиб. Мед.*, 2006. – Приложение 2.
3. Куксёнок В. Ю. Дисс. ... канд. хим. наук. – Томск: НИ ТПУ, 2016. – 178 с.

СИНТЕЗ И СВОЙСТВА БЕНЗОТИАЗОЛИЛЗАМЕЩЕННЫХ НИТРОЗОПИРАЗОЛОВ

П. С. Бобров, Я. И. Агеев, Д. К. Нижибовская
Научный руководитель – д.х.н., профессор Г. А. Субоч

Сибирский государственный университет науки и технологий имени академика М. Ф. Решетнева 660037, Россия, г. Красноярск, просп. им. газ. «Красноярский рабочий», 31, pavel.bobrov96@mail.ru

В настоящее время активно ведётся поиск новых методов синтеза и функционализации N-гетарилпиразолов, поскольку они обладают высокой биологической активностью. Так, N-гетарилпиразолы проявляют антибактериальную, гипотензивную, противовирусную активность, являются антидепрессантами и противораковыми агентами [1–4].

Особое значение имеют N-гетарилпиразолы с функциональными заместителями в 4-м положении пиразольного цикла. Однако, существующие методы синтеза позволяют получать N-гетарилпиразолы с ограниченным кругом заместителей. Перспективным направлением решения этой задачи является введение нитрозо-группы, поскольку она позволяет осуществлять переход к широкому ряду других классов органических соединений. Недавно мы показали, что взаимодействие гетарилгидразинов, в частности гидразинилхиноксалинов, с 2-гидроксимино-1,3-дикетонами успешно приводит к соответствующим 4-нитрозопиразолам [5]. Однако, до сих пор не была изучена циклоконденсация 2-гидразинилбензотиазола с 2-гидроксимино-1,3-дикетонами. Успешное осуществление такой реакции позволит получить ряд ранее неизвестных 1-(бензотиазол-2-ил)-4-нитрозопиразолов, и далее модифицировать нитрозогруппу до соответствующих классов соединений.

В данной работе мы впервые осуществили циклоконденсацию 2-гидразинилбензотиазола с алкил- и арилзамещёнными 2-гидрокси-

но-1,3-дикетонами в уксусной кислоте. Выходы N-гетарилнитрозопиразолов составили 18–65 %. Окисление бензотиазолилзамещённого нитрозопиразола пероксидом водорода в уксусной кислоте привело к соответствующему нитропиразолу с выходом 68 %, а при восстановлении нитрозосоединения гидразингидратом в присутствии Pd/C получен соответствующий аминопиразол (выход 74 %). Дальнейшая модификация аминогруппы позволила получить ранее неизвестные азо-, бензамидо-, ацетамидо- и иминопипразолы с хорошими выходами (Схема 1).

Таким образом, в результате проведённых исследований мы впервые осуществили циклоконденсацию 2-гидразинилбензотиазола с 2-гидроксимино-1,3-дикетонами и получили 15 ранее неизвестных соединений, строение которых подтверждено результатами электронной, ИК-, масс-, ЯМР ¹H и ЯМР ¹³C спектроскопии. Полученные продукты могут найти применение в качестве модификаторов эластомерных композиций, а также в качестве биологически активных веществ.

Работа была выполнена при финансовой поддержке Красноярского краевого фонда науки, код заявки: 2022030308319.

Участие в Международной конференции «Химия и химическая технология в XXI веке» по проекту №2022030308319 осуществлено при поддержке Красноярского краевого фонда науки.