

Схема 1. Реакция бетулина (1) с 4-ацетамидо-2-ацетоксибензойной кислотой (2)

Структура впервые синтезированного вещества (3) доказана с привлечением физико-химических методов анализа: ЯМР  $^1\text{H}$  и  $^{13}\text{C}$ , ИК-спектроскопии. Литературные данные о свойствах соединения (3) не найдены.

Таким образом, нами впервые проведена реакция О-ацилирования бетулина (1) с исполь-

зованием 4-ацетамидо-2-ацетоксибензойной кислоты (2), в результате синтезирован новый сложный эфир – 28-(4'-ацетамидо-2'-ацетоксибензоат) бетулина (3), являющийся потенциальным носителем биологической активности.

### Список литературы

1. Сафина А. В., Сайфутдинов Д. М., Хайрутдинова А. Р., Валеев К. В. // *Деревообрабатывающая промышленность*, 2017. – № 4. – С. 11–17.
2. Салахутдинов Н. Ф., Лаев С. С. *Препаративная химия терпеноидов: в 5 ч. Ч. 3.* – Новосибирск: Академиздат, 2016. – 363 с.
3. Казакова О. Б., Смирнова И. Е., Медведева Н. И. [и др.] // *Биоорганическая химия*, 2019. – Т. 45. – № 6. – С. 664–672.
4. Лупеева А. В., Долгих М. П., Толстикова Т. Г., Шульц Э. Э. // *Биоорганическая химия*, 2020. – Т. 46. – № 2. – С. 115–123.
5. Kashiwada Y., Chiyo J., Ikeshiro Y., Nagao T., Okabe H., Cosentino L. M., Fowke K., Lee K. H. // *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 2001. – Vol. 11. – № 2. – P. 183–185.
6. Воробьева О. А., Малыгина Д. С., Грубова Е. В., Мельникова Н. Б. // *Химия растительного сырья*, 2019. – № 4. – С. 407–430.

## ИССЛЕДОВАНИЕ СВОЙСТВ ПИРИДИН-2-ИЛ СУЛЬФОНАТОВ В РЕАКЦИЯХ N- И O-ЗАМЕЩЕНИЯ

К. Д. Ерин, А. Н. Санжиев, Е. А. Краснокутская  
 Научный руководитель – д.х.н., руководитель НОЦ Н. М. Кижнера Е. А. Краснокутская  
 Национальный исследовательский Томский политехнический университет  
 Россия, 634050, г. Томск, проспект Ленина, дом 30, kde2@tpu.ru

N-замещенные 2-пиридоны и их близкие аналоги являются важными компонентами как в натуральных продуктах, так и во многих активных фармацевтических препаратах [1, 2]. O-замещенные 2-пиридоны также являются фрагментами биологически значимых молекул [3], лекарственных средств [4] и продуктов естественного происхождения [5].

В работе [6], представленной нашей научной группой, впервые была показана способность пиридин-2-ил камфорасульфонов к образованию N- и O-алкилированных 2-пиридонов как в условиях основного алкоголиза, так и при

взаимодействии с изопропилбромидом в присутствии  $\text{K}_2\text{CO}_3$ .

Целью нашей работы является оптимизация метода получения N- и O-замещенных 2-пиридонов из пиридинил сульфонов с расширением ряда алкилирующих и арилирующих агентов, а также изучение реакционной способности субстратов в зависимости от природы сульфонатной группы.

Использование  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$  вместо  $\text{K}_2\text{CO}_3$  в опыте с *i*-PrBr сократило время реакции в 3 раза (с 6 до 2 часов) и способствовало увеличению выхода продукта **2a** на 11 %, что делает использование карбоната цезия более предпочтительным

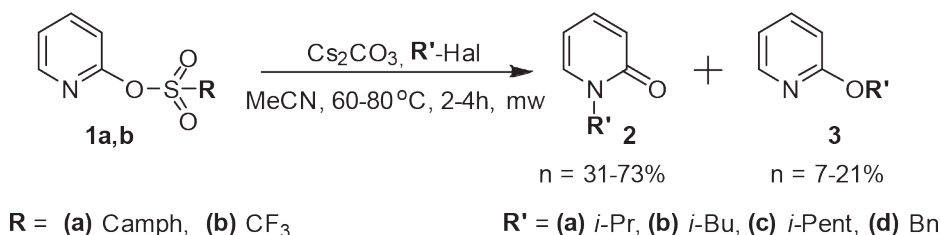


Схема 1.

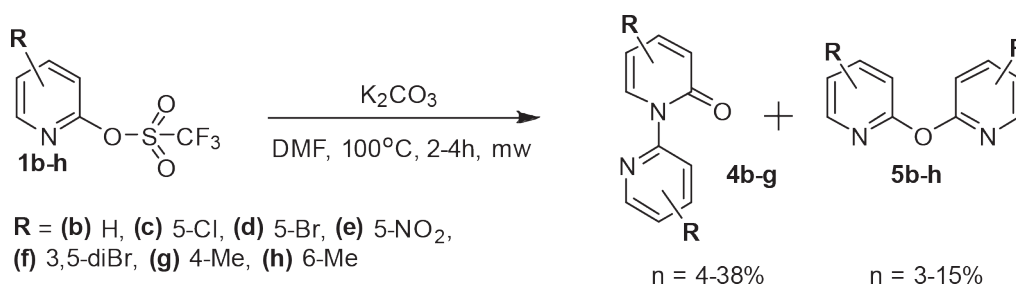


Схема 2.

(схема 1). Использование данного основания также позволило получить продукты **2a** и **3a** из пиридинил-2-трифлата **1b**, тогда как с  $\text{K}_2\text{CO}_3$  конверсии субстрата не наблюдалось вовсе.

На момент написания работы, самый высокий выход замещенных продуктов был зафиксирован в случае превращения субстрата **1a** в продукты **2d** и **3d**, где он составил 73 и 21% соответственно.

Помимо этого, пиридин-2-ил трифлаты **1b-h** при повышенной до 100 °С температуре в присутствии основания в ДМФА реагируют сами с собой с образованием N- и O-гетероариллированных продуктов **4b-g** и **5b-f, h** соответственно (схема 2). Пиридин-2-ил камфорасульфونات в

данных условиях термически разрушаются, что делает их неподходящими субстратами.

Примечательно, что в случае с 6-метилпиридин-2-ил трифторметансульфонатом (**1h**) мы имеем только один продукт реакции **5h**, тогда как в остальных случаях получается смесь продуктов **4** и **5**, что говорит о влиянии стерического фактора на замещение по атому азота.

На данный момент продолжается работа по оптимизации условий реакции – повышение выхода и селективности. Также ведется подбор условий, который позволит использовать пиридин-2-ил камфорасульфونات в реакции гетероариллирования.

### Список литературы

1. Rouden J., Lasne M. C. et al. // *J. Chem. Rev.*, 2014. – V. 114. – № 1. – P. 712–778.
2. Adibatti N. A., Thirugnanasambantham P. et al. // *Phytochemistry*, 1991. – V. 30. – № 7. – P. 2449–2450.
3. Carlson A. S., Cui H. et al. // *ACS Med. Chem. Lett.*, 2019. – V. 10. – № 9. – P. 1296–1301.
4. Duan H., Ning M. et al. // *J. Med. Chem.*, 2012. – V. 55. – № 23. – P. 10475–10489.
5. Gray D., Gallagher T. // *Angew. Chem., Int. Ed.*, 2006. – V. 45. – № 15. – P. 2419–2423.
6. Sanzhiev A. N., Krasnokutskaya E. A., Erin, K. D. et al. // *Russ J Org Chem.*, 2021. – V. 57. – № 26. – P. 922–929.