

продолжили наши совместные исследования [7], используя в качестве N-содержащих реагентов 1-[(3-хлорфенил)(фенил)метил]мочевину 2a (галодиф) и 1-(2,3-диметил-5-оксо-1-фенил-2,5-дигидро-1H-пиразол-4-ил)мочевину 2b (антипиримочевину) для модификации бетулина.

В ходе работы нами установлено, что реакция бетулина 1 с мочевиной 2a и 2b в условиях сплавления приводит к преимущественному образованию 28-монозамещенных карбаматов

бетулина 3a и 3b соответственно.

Строение синтезированных соединений 3a и 3b было доказано с использованием методов ИК-, ЯМР (^1H и ^{13}C). Отметим, что физико-химические свойства карбаматов 3a и 3b не были найдены в литературе.

Таким образом, впервые полученные N-содержащие карбаматы бетулина 3a и 3b представляют интерес как потенциальные носители биологической активности.

Список литературы

1. Толстиков Г.А., Флехтер О.Б., Шульц Э.Э., Балтина Л.А., Толстиков А.Г. // *Химия в интересах устойчивого развития*, 2005.– №13.– С.1–30.
2. Кузнецова С.А., Скворцова Г.П., Маляр Ю.Н., Скурыдина Е.С., Веселова О.Ф. // *Химия растительного сырья*, 2013.– №2.– С.93–100.
3. Kommera H., Kaluđerović G.N., Dittrich S., Kalbitz Ju., Dräger B., Mueller Th., Paschke R. // *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 2010.– Vol.20.– P.3409–3412.
4. Wiemann Ja., Heller L., Perl V., Kluge R., Ströhl D., Csuk R. // *Eur. J. Med. Chem.*, 2015.– Vol.106.– P.194–210.
5. 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.
6. Bakibaev A.A., Gorshkova V.K., Saratikov A.S. // *Pharmaceutical Chem. Journal*, 1997.– V.31.– №2.– P.53–67.
7. Калиева С.С. *Диссертация на соискание степени доктора философии*.– Астана: Евразийский национальный университет имени Л.Н. Гумилева, 2017.– 94с.

СИНТЕЗ ГАММА-ПИРИДИЛЗАМЕЩЕННЫХ ПАРА-НИТРОЗОФЕНОЛОВ С БУТОКСИКАРБОНИЛЬНЫМИ ЗАМЕСТИТЕЛЯМИ

А.Д. Раджабов, А.А. Кукушкин, Е.В. Роот
 Научный руководитель – д.х.н., профессор М.С. Товбис

Сибирский государственный университет науки и технологий имени академика М.Ф. Решетнева
 660037, Россия, г. Красноярск, пр. имени газеты «Красноярский рабочий» 31, amirajabov1997@gmail.com

Известно, что аминифенолы, содержащие пиридиновый фрагмент обладают фунгицидной активностью [1]. Они количественно получают при восстановлении соответствующих нитрозофенолов [2]. Введение других, особенно жирорастворимых, заместителей в сложноэфирные группы, позволит изменить проницаемость вещества через биологические мембраны.

Ранее нами был впервые синтезирован ряд

гексазамещенных солей нитрозофенолов с пиридиновым заместителем в ароматическом ядре [3] которые были выделены в свободном виде [4]. На настоящий момент получены пиридилзамещенные пара-нитрозофенолы, содержащие только метоксикарбонильную и этоксикарбонильную группы. Учитывая, что растворимость соединений значительно изменяется при увеличении длины алкильных групп, представляет

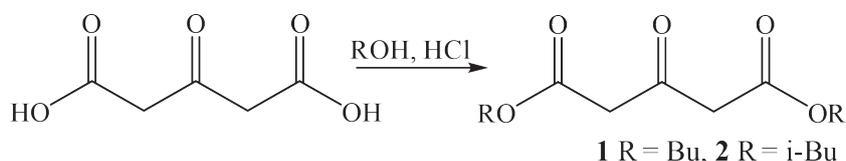


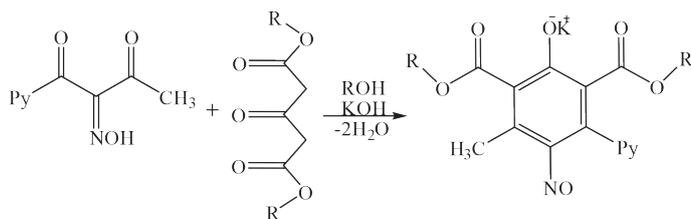
Схема 1.

интерес получить пиридилзамещенные пара-нитрозофенолы с изомерными бутоксикарбонильными заместителями.

Для этого мы синтезировали бутиловый и изобутиловый эфиры 3-оксопентандиовой кислоты по следующей схеме [5]:

Полученные эфиры (**1**, **2**) вводили в циклоконденсацию с 2-гидроксиимино-1-(пиридин-4-ил)-бутандионом-1,3.

В 3 мл соответствующего абсолютного спирта растворяли 0,25 ммоль гидроксида калия, затем добавляли 0,5 ммоль эфира 3-оксопентандиовой кислоты (**1**, **2**) и 0,5 ммоль 1-(пиридин-4-ил)-бутандиона-1,3. Реакционную смесь выдерживали 75 мин. при 18–20 °С. Калиевую соль (**3**, **4**) выделяли разбавлением реакционной массы абсолютным диэтиловым эфиром. Выпавшие ярко-зеленые кристаллы отфильтровывали, перекристаллизовывали из соответствующего спирта, сушили в вакууме над Na_2SO_4 .



3 R = Bu, **4** R = i-Bu

Схема 2.

Выход составил для **3** – 47%, для **4** – 26%, это, вероятно, объясняется пространственными затруднениями изомерных бутоксикарбонильных заместителей. Строение впервые полученных калиевых солей (**3**, **4**) подтверждено УФ спектрами, в которых имеются максимумы поглощения в области 634–642 нм с небольшой экстинкцией: **3** – 642 (47), **4** – 634 (43).

Список литературы

1. Кукушкин А.А., Бондарь П.Н., Любяшкин А.В., Товбис М.С. Фунгицидная активность полностью замещенных аминофенолов с γ -пиридиновым заместителем // *Science, society, progress: Proceedings of articles the international scientific conference. Czech Republic, Karlovy Vary - Russia, Moscow, 2017.* – С.19–24.
2. Синтез перзамещенных аминофенолов, содержащих пиридиновый фрагмент [Текст] / А.А. Кукушкин, Е.В. Рот, М.С. Товбис, А.В. Скрипальщикова, Е.В. Кулумаева // *Всероссийская научно-практическая конференция «Лесной и химический комплексы – проблемы и решения».* Красноярск, 2015. – С.6–7.
3. Кукушкин А.А., Рот Е.В., Кондрасенко А.А., Субоч Г.А., Товбис М.С. *ЖОрХ*, 2015. – 51. – 749. [Kukushkin A.A., Root E.V., Kondrasenko A.A., Suboch G.A., Tovbis M.S. *Russ. J. Org. Chem.*, 2015. – 51. – 733].
4. Получение новых перзамещенных 4-нитрозофенолов с пиридиновым заместителем [Текст] / А.А. Кукушкин, Е.В. Рот, М.С. Товбис, Г.А. Субоч, Е.В. Кулумаева, А.А. Кондрасенко // *Журн. орган. химии*, 2016. – Т.52. – Вып.8. – С.1219–1221.
5. Besthorn E. Ueber die Einwirkung von Acetondicarbonsäureester auf Anilin [Text] / E. Besthorn, E. Garden // *Berichte*, 1903. – №33. – P.3439–3447.

РАЗРАБОТКА МЕТОДИКИ ТЕСТИРОВАНИЯ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ НА МОДЕЛИ ПЕКАРСКИХ ДРОЖЖЕЙ

К.М. Райымкулова

Научный руководитель – к.х.н., доцент М.Л. Белянин

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

В настоящее время актуален поиск противогельминтных препаратов. Однако быстрых и дешевых методов скрининга соединений на антигельминтную активность нет. Одной из молекулярных мишеней для подавления процессов дыхания гельминтов является фермент – фума-

ратредуктаза (ФР) [1]. Большинство гельминтов являются анаэробами, хотя содержат и дыхательную цепь, одним из компонентов которой является сукцинатдегидрогеназа (СДГ). Это придает им сходство с дрожжами, которые в зависимости от условий могут быть аэробами или анаэроба-