

биетана известна 12-сульфогидроабиетиновая кислота, применяемая для лечения язвы желудка и эрадикации *Helicobacter Pylori* [5].

Для получения новых сероорганических соединений на основе этилового эфира дегидроабиетиновой кислоты **1** нами синтезирован кетон **2**, содержащий дополнительно сложноэфирную группу, который восстанавливали  $\text{LiAlH}_4$  до соответствующего диола **3**. Восстановление кетогруппы протекает стереоселективно – хиральный центр С-7 диола **3** имеет (*S*)-конфигурацию. Так как спирты бензильного типа обладают повышенной реакционной способностью, то восстановление  $\text{LiAlH}_4$  протекает с образованием побочного спирта **4** и смеси неидентифицированных продуктов, общее содержание которых в реакционной смеси не превышает 8 % (схема 1).

Взаимодействием спирта **3** с тиоуксусной кислотой в присутствии кислоты Льюиса ( $\text{ZnCl}_2$ ) впервые получен тиоацетат **5**, имеющий противоположную спирту **3** конфигурацию хирально-

го центра С-7. В качестве побочного продукта образовался диэфир **6** с выходом 21 %. В случае отсутствия тиоуксусной кислоты в реакционной смеси выход соединения **6** количественный. При его образовании одна из гидроксильных групп является направляющей для присоединения второй к образующемуся карбокатиону **7** с той же стороны плоскости молекулы, поэтому в соединении **6** конфигурация атома С-7, по сравнению с исходным спиртом **3**, также обращенная. Увеличение концентрации тиоуксусной кислоты в той же самой реакции не способствует уменьшению выхода циклического димера **6** (схема 2).

Тиоацетат **5** восстановлен  $\text{LiAlH}_4$  до соответствующего тиола **8** с выходом 29 %. Обработкой тиоацетата **5** метилатом натрия, или тиола **8** иодом, был получен дисульфид **9** (85 %).

Исследование выполнено с использованием оборудования Центра коллективного пользования (ЦКП) «Химия» Института химии ФИЦ Коми НЦ УрО РАН.

### Список литературы

1. Politi M., Braca A., Tommasi N. D. et al. // *Planta Med.*, 2003. – V. 69. – № 5. – P. 468–470.
2. Iwamoto M., Minami T., Tokuda H., Ohtsu H. et al. // *Planta Med.*, 2003. – V. 69. – № 1. – P. 69–72.
3. Ulubelen A., Topcu G., Johansson C.B. // *J. Nat. Prod.*, 1997. – V. 60. – № 12. – P. 1275–1280.
4. Son K.-H., Oh H.-M., Choi S.-K. et al. // *Bioorg. Med. Chem. Lett.*, 2005. – V. 15. – № 8. – P. 2019–2021.
5. Ito Yu., Shibata K., Hongo A. et al. // *Eur. J. Pharmacol.*, 1998. – V. 345. – № 2. – P. 193–198.

## АРИЛИРОВАНИЕ ОКСАЗОЛИДИНОВ С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ ДИАРИЛИОДОНИЕВЫХ СОЛЕЙ

Е. В. Подрезова, Н. С. Солдатова, П. С. Постников

Томский политехнический университет

634043, Россия, Томск, ул. Ленина, д. 43а, katerina.podrezova06@mail.ru

Азотсодержащие гетероциклические соединения широко используются не только как важные строительные блоки в органической химии, но в синтезе лекарственных препаратов (антигипертензивных лекарственных средств, антибиотиков и др). Гетероциклы имеют огромное значение для медицинской химии, поскольку их использование позволяет создавать принципиально новые лекарственные препараты, так и модифицировать уже существующие для уменьшения токсичности, управления липофильностью, биодоступностью и метаболической стабильностью [1, 2]. Поэтому несмотря

на большую библиотеку полученных гетероциклических соединений, поиск и синтез новых является актуальной задачей, в рамках которой немаловажным остается разработка новых методов синтеза.

Оксазолидиноны уже зарекомендовали себя как вещества, обладающие полезной биологической активностью, применяемые для создания новых антибиотиков, таких как тедизолид или линезолид и другие (Схема 1).

В связи с этим разработка мягкого и селективного метода N-арилирования оксазолидино-

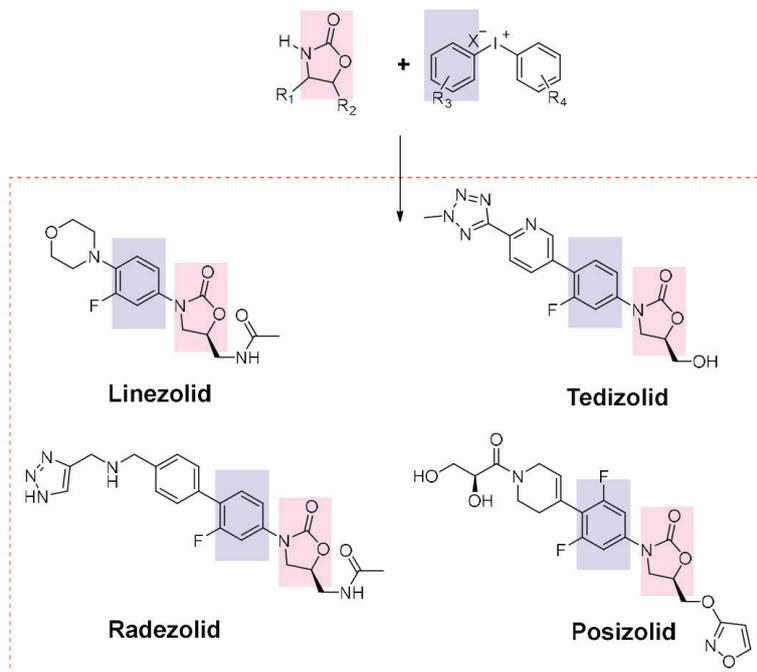


Схема 1. Лекарственные соединения на основе оксазолидинонов

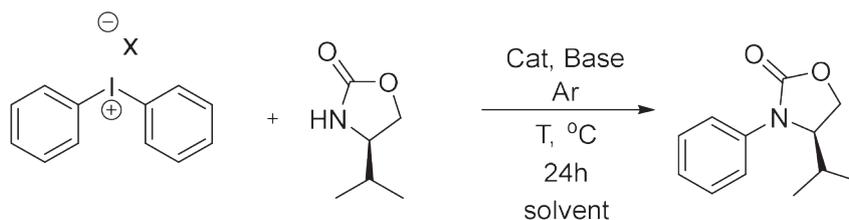


Схема 2. Реакция оптимизации арилирования оксазолидинонов

нов безусловно является актуальной областью исследования.

На первом этапе работы проводилась оптимизация с использованием 4-изопропил-оксазолидин-2-она как модельного субстрата, совмещающего в себе простоту структуры и изопропилную группу, затрудняющую арилирование атома азота (схема 2). В качестве арилирующего агента мы использовали диарилиодониевые соли, которые широко применяются в органическом синтезе [3].

В рамках оптимизации мы оценили влияние температуры, времени, природы растворителей, оснований, анионов, различных катализаторов и иодониевых солей.

Таким образом, мы разработали селективный метода N-арилирования оксазолидинонов с выходом 94 %.

Работа выполнена при поддержке Гранта Президента Российской Федерации для государственной поддержки молодых российских ученых МК-337.2022.1.3.

### Список литературы

1. Jampilek J. *Heterocycles in medicinal chemistry* // *Molecules*, 2019. – Vol. 24 (21). – P. 3839.
2. S Jadhavar, P., D Vaja, M., M Dhameliya, T. and K Chakraborti, A., *Oxazolidinones as anti-tubercular agents: discovery, development and future perspectives* // *Current medicinal chemistry*, 2015. – Vol. 22 (38). – P. 4379–4397.
3. Yusubov M. S., Svitich D. Y., Larkina M. S. and Zhdankin V. V., *Applications of iodonium salts and iodonium ylides as precursors for nucleophilic fluorination in Positron Emission Tomography* // *ARKIVOC: Online Journal of Organic Chemistry*, 2013. – P. 364–395.