

PR-87

СИНТЕЗ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ ПРОИЗВОДНЫХ АМИНОАЗИНОВ

Казакова Е. Д.¹, Мусихина А. А.^{1,2}, Утепова И. А.^{1,2}, Чупахин О. Н.^{1,2}, Зырянова Е. Ю.¹

¹Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского, УрО РАН, 620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая, 20/22;

²Уральский Федеральный Университет им. первого Президента России Б. Н. Ельцина, 620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19.

E-mail: a.a.musikhina@urfu.ru

Развитие методов селективного построения С-N связей является важным направлением в современном органическом синтезе, поскольку соединения, содержащие аминогруппы или их производные, как правило, проявляют биологическую активность широкого спектра, а также нашли свое применение в химической технологии и биотехнологии [1]. Наиболее общим методом получения таких соединений является нуклеофильное замещение галогенов или других нуклеофугных групп как в отсутствие катализатора [2], так и в каталитических условиях [3].

Так, в результате проведенных исследований был получен ряд аминопроизводных моно-, ди- и три- азинов, а также их активированных форм (N-оксидов, онов). В качестве основного синтетического подхода был использован метод прямого окислительного аминирования с использованием литийаминов в качестве нуклеофилов (Схема 1). Проведение же реакции со вторичными аминами в присутствии окислителя $\text{AgPy}_2\text{MnO}_4$ позволило получить более широкий ряд аминоазиннов.

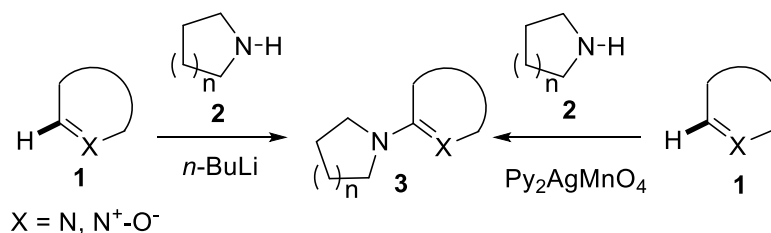


Схема 1. Синтез производных аминоазиннов.

Строение полученных соединений было подтверждено при помощи элементного анализа, метода РСА, ЯМР спектроскопии и масс-спектрометрии.

Было установлено, что производные аминоазиннов, а также их активированные формы (N-оксиды, азиноны, четвертичные соли) проявляют высокую радикал-связывающую активность в АВТС-тесте, сравнимую или превышающую активность стандартного антиоксиданта Тролокса. Железо-восстанавливающая активность соединений (метод FRAP) оказалась несколько ниже, чем у стандарта.

Библиографический список

- Corey, E. J. *Molecules and medicine* / E. J. Corey, B. Czako, L. Kurti // John Wiley & Sons, Hoboken, NJ. – 2007. – P. 272.
- Kienle, M. *Modern amination reactions* / M. Kienle, S. R. Dubbaka, K. Brade, P. Knochel // *Eur. J. Org. Chem.* – 2007. – №25. – P. 4166–4176.
- Liang, J. *Metal-catalyzed cross-coupling reactions*, 2nd ed. / J. Liang, S. L. Buchwald, De A. Meijere, F. Diederich, Eds // Wiley-VCH: Weinheim, Germany. – 2004. – P. 699.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского фонда фундаментальных исследований (грант № 20-43-660054 и №19-2908037) и Министерства науки и высшего образования Российской Федерации. Государственный контракт № FEUZ-2020-0058 (Н687/42Б.223/20).