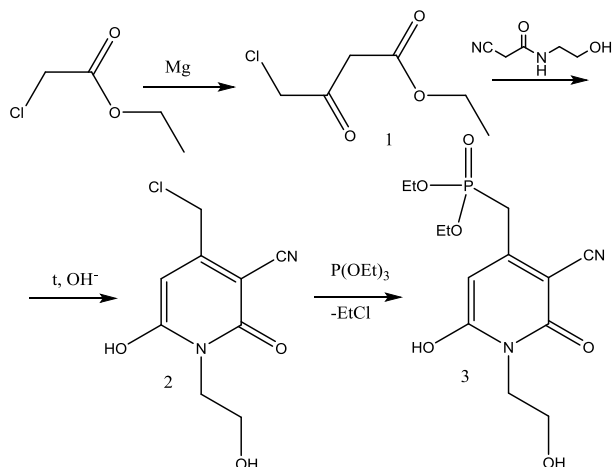




Найдено, что взаимодействие протекает с образованием диэтил ((3-циано-6-гидрокси-1-(2-гидроксиэтил)-2-оксо-1,2-дигидропиридин-4-ил)метил)фосфоната 3. Дальнейшее нагревание с целью получения оксазоло[3,2-а]пиридинов не дало ожидаемого результата, что связано сильным осмолением реакционной массы. Структуры предложены из данных хроматомасс, ИК, ¹H спектроскопии. Таким образом, доступность исходных веществ и легкость получения замещенных пиридинов увеличивает значимость синтеза соединений, в структуре которых присутствуют фрагменты, определяющие биологически активную составляющую. В то же время наличие фосфорсодержащего заместителя усиливает биодоступность синтезированных пиридинов.

ONE-ПОТ МЕТОД СИНТЕЗА МЕТИЛОВОГО ЭФИРА 2-ГАЛОГЕН-6-АЛКИЛ-3-ЦИАНОИЗОНИКОТИНОВЫХ КИСЛОТ

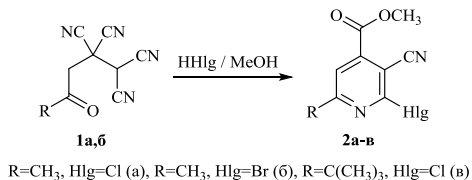
Липин К.В.

Чувашский государственный университет
428015, г. Чебоксары, пр. Московский, д. 15

Производные изоникотиновой кислоты находят широкое практическое применение: на сегодняшний день используется ряд противотуберкулезных препаратов и антидепрессантов-ингибиторов моноаминоксидазы. Также в литературе имеются сведения о бактерицидной и другой биологической активности производных изоникотиновой кислоты. Учитывая вышеописанное, можно утверждать, что поиск новых ме-

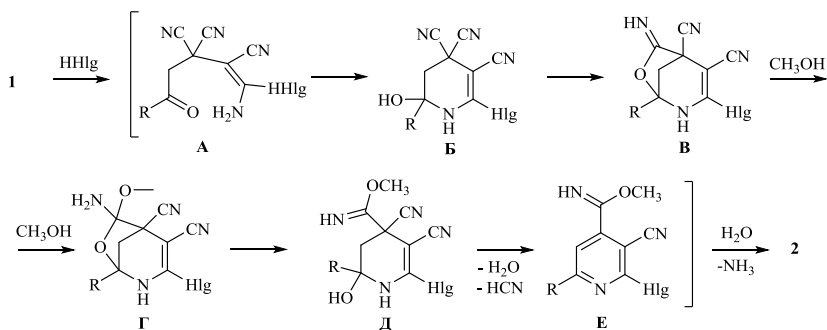
тодов синтеза труднодоступных соединений этого ряда является актуальной задачей.

Нами разработан новый способ получения производных изоникотиновой кислоты. Трехкомпонентный синтез метиловых эфиров 2-галоген-6-алкил-3-цианоизоникотиновых кислот **2a-в** был осуществлен при действии на 4-оксоалкан-1,1,2,2-тетракарбонитрилы **1** галогеноводородов в среде метанола (см. рисунок ниже). Выходы реакции составили 76-82%.



Структура синтезированных соединений подтверждена методами ИК, ЯМР ^1H спектроскопии и масс-спектрометрии, а пиридина **2a** – также данными ЯМР ^{13}C спектроскопии и гетероядерной двумерной спектроскопией (HMBC).

Для образования соединений **2** можно предложить схему превращений, включающую на первой стадии присоединение галогеноводорода по терминальной цианогруппе и последующее формирование тетрагидропиридина **Б** (см. рисунок ниже). В случае использования метанола происходит формирование иминолактонного цикла **В** за счет внутримолекулярного взаимодействия пространственно сближенных гидроксигрупп и цианогрупп. Далее метанол присоединяется по иминогруппе, что приводит к образованию интермедиата **Г**. Ацетальамид **Г** неустойчив и превращается в иминоэфир **Д**. Последний ароматизируется за счет процессов дегидратации и дегидроцианирования до пиридина **Е**. На последней стадии иминный фрагмент интермедиата **Е** гидролизуется, что приводит к метиловому эфиру 2-галоген-6-алкил-3-цианоизоникотиновой кислоты **2**.



Исследование выполнено в рамках стипендии Президента РФ для молодых ученых и аспирантов СП-2782.2015.4.

СИНТЕЗ ПРОИЗВОДНЫХ УРАЦИЛОВ С ДВОЙНОЙ СВЯЗЬЮ

Мамедов Э.Ш., Велиева Д.С., Кулубекова Т.С., Кулиева З.С.,

Гюлахмедова С.А., Алиева Т.Ч.

Институт катализа и неорганической химии НАН Азербайджана

1143, г. Баку, пр. Г. Джавида, д. 113

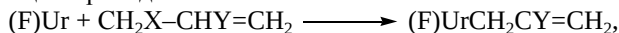
К перспективным соединениям в химии нуклеозидов относится урацил, среди производных которого обнаружены соединения, обладающие биологически активными свойствами широкого спектра действия, что обуславливает использование их в медицине в качестве лекарственных препаратов.

В состав средств, ускоряющих процессы клеточной регенерации, входят производные урацила. Некоторые мази, кремы и др. парфюмерные изделия содержат урацильные фрагменты, многие гербицидные композиции также основываются на производных урацила.

Ранее нами было получены аллилпроизводные 5-фтор- и 6- метилурацилов, проявивших биоактивность к различным тест-культурам и превышающие таковые у многих известных препаратов.

В данной работе представлены вновь синтезированные галоген-содержащие аллилпроизводные урацилов, имеющие в своем составе двойную связь, реакцией урацила (Ur) и 5-фторурацила (Fur) с дигалогидпропенами (2,3-дихлорпропен, 2,3-дибромпропен и 2-метил-3-хлорпропен) в растворе диметилсульфоксида.

Реакции проводились по схеме:



где $X=Y=Cl$, Br $X=Cl$, $Y=CH_3$