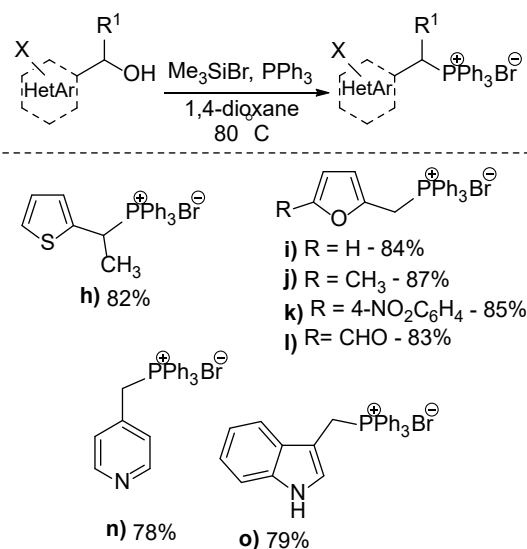


гидробромида взаимодействием трифенилфосфина с триметилбромсиланом в диоксане с дальнейшим добавлением соответствующего спирта.



Список литературы

1. Dupart P. S., Mitra K., Lyons C. E. et al. // Chem. Commun. 2019. P. 5607–5610.
2. Xu K., Liu D., Sheng C. et al. // Tetrahedron. 2018. P. 5996–6002.
3. Hu P., Berning K., Lam Y. et al. // J. Org. Chem. 2018. P. 12998–13010.

* Работа выполнена при поддержке гранта РФФ 19-73-00203.

УДК 547.821.3:577.175.19

Э. Р. Шакурова, Л. В. Парфёнова

Институт нефтехимии и катализа УФИЦ РАН,
450075, Россия, г. Уфа, пр. Октября, 141,
luda_parfenova@ipc-ras.ru

ОРГАНИЧЕСКИЕ ТРИБРОМИДЫ – ЭФФЕКТИВНЫЕ РЕАГЕНТЫ ДЛЯ ОДНОРЕАКТОРНОГО СИНТЕЗА ПИРИДИНИЕВЫХ АНАЛОГОВ ЛУПАНОВЫХ ТРИТЕРПЕНОИДОВ

Ключевые слова: бетулин, трибромиды, кватернизированные пиридиниевые соли, замещённые пиридины.

Четвертичные аммонийные соединения широко применяются в качестве антисептических средств, механизм антибактериального действия которых заключается в их адсорбции и проникновении через клеточную стенку бактерий с последующим взаимодействием с фосфолипидами цитоплазматической

мембраны, что приводит к полной структурной дезорганизации и последующей гибели бактериальной клетки [1, 2]. Доказана эффективность четвертичных аммонийных солей в отношении липидсодержащих вирусов, а также способность взаимодействовать с внутриклеточными мишенями и связываться с ДНК клеток различных опухолевых линий [3].

Основным подходом к синтезу четвертичных аммонийных солей является реакция кватернизации, основанная на N-алкилировании третичных аминов алкил- или арилгалогенидами (реакция Меншуткина) [4].

Ранее нами был разработан эффективный однореакторный способ получения новых кватернизированных пиридиновых производных бетулина, обладающих выраженной антибактериальной и противогрибковой активностью, заключающийся во взаимодействии исходных лупановых тритерпеноидов с реагентом $\text{TEMPO}^+\text{Br}_3^-$ в пиридине [5, 6].

В продолжение этих исследований в представленной работе изучена возможность использования других органических трибромидов (тетрабутиламмоний трибромид (ТВА Br_3), трибромид пиридиния ($\text{Py} \cdot \text{HBr} \cdot \text{Br}_2$)) в качестве бромлирующих агентов, а также расширен ряд пиридинов (3,5-лутидин (3), 2,6-лутидин, 4-пиколин (4) и 2,4,6-коллидин), вовлекаемых в данную реакцию (схема).

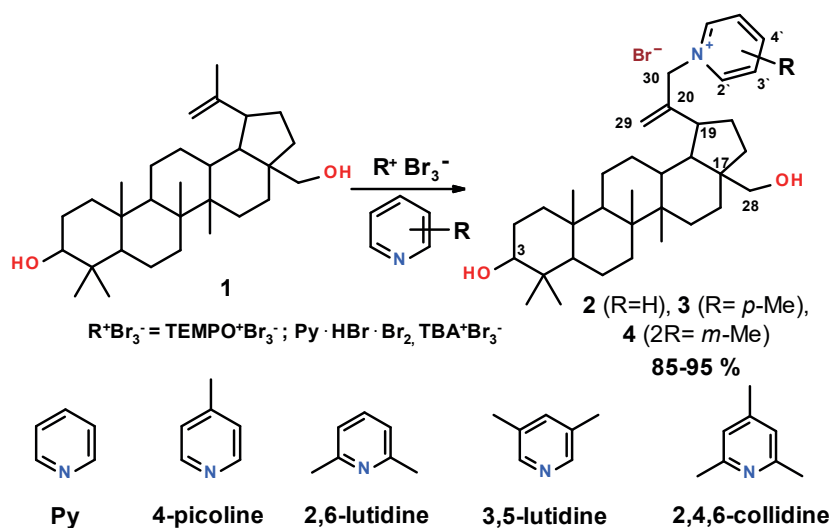


Схема. Однореакторный синтез пиридиновых производных бетулина

В результате установлено, что реакция кватернизации в присутствии $\text{TEMPO}^+\text{Br}_3^-$ катиона успешно реализуется только для пиридина. Метилзамещенные пиридины 3,5-лутидин и 4-пиколин вступают в реакцию как в присутствии $\text{TVA}^+\text{Br}_3^-$, так и в присутствии $\text{Py} \cdot \text{HBr} \cdot \text{Br}_2$. Использование 2,6-лутидина и 2,4,6-коллидина не приводит к образованию целевых продуктов, по-видимому, благодаря действию стерического фактора. Таким образом, были получены пиридиновые соли 2–4 на основе бетулина 1 с выходами 85–95 %, представляющие интерес в качестве новых антимикробных агентов. Использование трибромидов в реакции кватернизации позволяет избегать

дополнительной стадии бромирования бетулина, что сокращает стадийность процесса и увеличивает выход реакции.

Список литературы

1. Gerba C. P. // Appl. Env. Microbiol. 2015. Vol. 81. P. 464–469.
2. McDonnell G., Russell A. D. // Clin. Microbiol. Rev. 1999. Vol. 12. P. 147–179.
3. Zinchenko A. A., Sergeyev V. G., Yamabe K. et al. // Chembiochem. 2004. Vol. 5. P. 360–386.
4. Wojciechowska A., Wieszczycka K., Framski G. // Mod. Org. Chem. Res. 2017. Vol. 2. P. 41.
5. Shakurova E. R., Pozdnyakova D. A., Tretyakova E. V., Parfenova L. V. // Letters in Drug Design Discovery. 2020. Vol. 17. P. 79–84.
6. Shakurova E. R., Parfenova L. V. // Molbank. 2020. Vol. 2020 (1). P. M 1100.

УДК 547-3:54.057

Э. Р. Шакурова, Л. В. Парфёнова

*Институт нефтехимии и катализа УФИЦ РАН,
450075, Россия, г. Уфа, пр. Октября, 141,
luda_parfenova@ipc-ras.ru*

ТРЕХКОМПОНЕНТНЫЙ СИНТЕЗ АМИНОФОСФОНАТОВ НА ОСНОВЕ ФЕНИЛЕНДИАМИНОВ

Ключевые слова: аминоксффонаты, диэтилфосфит, 3-метилбензальдегид, фенилендиамины.

α -Аминофосфонаты, являясь аналогами аминокислот, нашли широкое применение в промышленности, сельском хозяйстве и медицинской химии благодаря своим уникальным биологическим и физическим свойствам [1–3]. Известно, что аминоксффонаты обладают противовоспалительной [4], антибактериальной [5], противоопухолевой [2] и противовирусной активностью [6].

Одним из методов получения аминоксффонатов является трехкомпонентный синтез, где в качестве исходных субстратов используют альдегиды, амины и алкилфосфиты. Синтез, как правило, проходит с участием кислотных катализаторов Льюиса и Бренстеда, в том числе трифлатов лантаноидов, сульфатов магния или скандия (трис-додecilсульфата) и др. [7]. Целью представленной работы является получение аминоксффонатов со свободной аминоксффной группой на основе ароматических диаминов в качестве биологически активных синтонов. Целевые соединения могут быть в дальнейшем