

Уменьшение выхода в ряду эфироаминоспиртов можно объяснить основностью используемых аминов. Также разработан одностадийный метод получения эфироаминоспиртов взаимодействием эквимольных количеств эпихлоргидрина со спиртами с постепенным введением двухкратного мольного количества амина, отделением осадка гидрохлорида амина и выделением продукта перегонкой. Состав и строение эфироаминоспиртов доказаны ЯМР ^1H , ИК-спектроскопией. Эфироаминоспирты, содержащие алициклические и ароматические фрагменты симметричного и несимметричного строения, проявляют антистафилококковый эффект. Было выявлено, что эфироаминоспирты, имеющие ароматические фрагменты, проявляют в основном анальгетическую, психотропную и противовирусную активность. Они могут быть использованы в качестве полупродуктов для синтеза лекарственных препаратов и как биологически активные вещества.

Список литературы

1. Зейналов С. Б. Эфиры алициклического ряда. Баку: Элм, 1996. 222 с.
2. Зейналов С. Б., Кязимова Т. Г. Эпихлоргидрин. Баку: Элм, 2003. 188 с.
3. А. С. 1574587 (СССР) Способ получения эфироаминоспиртов. Б. И. № 24. 30.06.90. 3 с.

УДК 547.745

Е. А. Булдакова¹, В. Л. Гейн¹, М. В. Дмитриев², И. Г. Мокрушин²

¹Пермская государственная фармацевтическая академия,
614990, Россия, г. Пермь, ул. Полевая, 2,
zingeldeeva@yandex.ru,

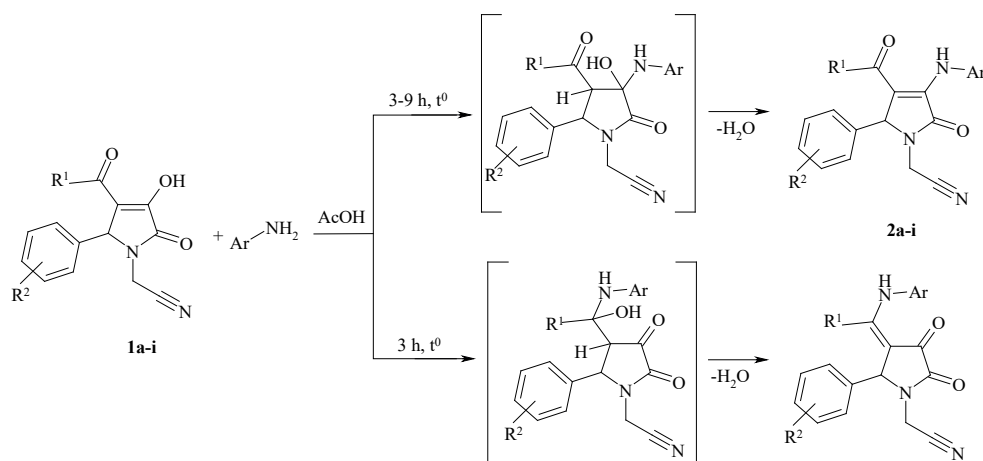
²Пермский государственный национальный
исследовательский университет,
614990, Россия, г. Пермь, ул. Букирева, 15

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ 5-АРИЛ-4-АЦИЛ- 3-ГИДРОКСИ-1-ЦИАНОМЕТИЛ-3-ПИРРОЛИН-2-ОНОВ С АРОМАТИЧЕСКИМИ АМИНАМИ

Ключевые слова: 5-арил-4-ацил-3-гидрокси-1-цианометил-3-пирролин-2-оны, 5-арил-4-(1-ариламиноэтилиден)-1-цианометил-тетрагидропиррол-2,3-оны, 5-арил-4-[арил(ариламино)метилен]-1-цианометилтетрагидропиррол-2,3-дионы, 5-арил-3-ариламино-4-ароил-1-цианометил-3-пирролин-2-оны, ароматические амины.

Широкое применение нестероидных противовоспалительных и местноанестезирующих средств, содержащих в своей структуре остаток ариламина [1], привлекло наше внимание к изучению взаимодействия ранее полученных 5-арил-4-ацил-3-гидрокси-1-цианометил-3-пирролин-2-онов **1a-i** [2, 3] с ароматическими аминами (схема).

Структура полученных соединений доказана данными ИК-, ЯМР ^1H - и масс-спектроскопией.



Схема

$\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = \text{H}$ (**1a**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$ (**1b**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-EtO}$ (**1c**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-(CH}_3)_2\text{N}$ (**1d**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = \text{H}$ (**1e**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$ (**1f**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-EtO}$ (**1g**); $\text{R}^1 = 4\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$ (**1h**); $\text{R}^1 = \text{Me}$, $\text{R}^2 = \text{H}$ (**1i**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = \text{Ph}$ (**2a**, **3a**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = 4\text{-MeC}_6\text{H}_5$ (**2b**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$, $\text{Ar} = 4\text{-MeC}_6\text{H}_5$ (**2c**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-EtO}$, $\text{Ar} = 4\text{-MeC}_6\text{H}_5$ (**2d**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = 4\text{-(CH}_3)_2\text{N}$, $\text{Ar} = 4\text{-MeC}_6\text{H}_5$ (**2e**); $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = 4\text{-EtC}_6\text{H}_5$ (**2f**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = 4\text{-CH}_3\text{C}_6\text{H}_5$ (**2g**, **3b**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-EtO}$, $\text{Ar} = 4\text{-EtC}_6\text{H}_5$ (**2h**); $\text{R}^1 = 4\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$, $\text{Ar} = 4\text{-EtC}_6\text{H}_5$ (**2i**, **3c**); $\text{R}^1 = 3\text{-NO}_2\text{C}_6\text{H}_5$, $\text{R}^2 = 4\text{-MeO}$, $\text{Ar} = 4\text{-EtC}_6\text{H}_5$ (**3d**); $\text{R}^1 = \text{Me}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = 4\text{-MeC}_6\text{H}_5$ (**3e**); $\text{R}^1 = \text{Me}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{Ar} = 4\text{-EtC}_6\text{H}_5$ (**3f**)

Для установления пространственного строения соединений **2i** и **3f** были получены монокристаллы, пригодные для рентгеноструктурного анализа (рис.).

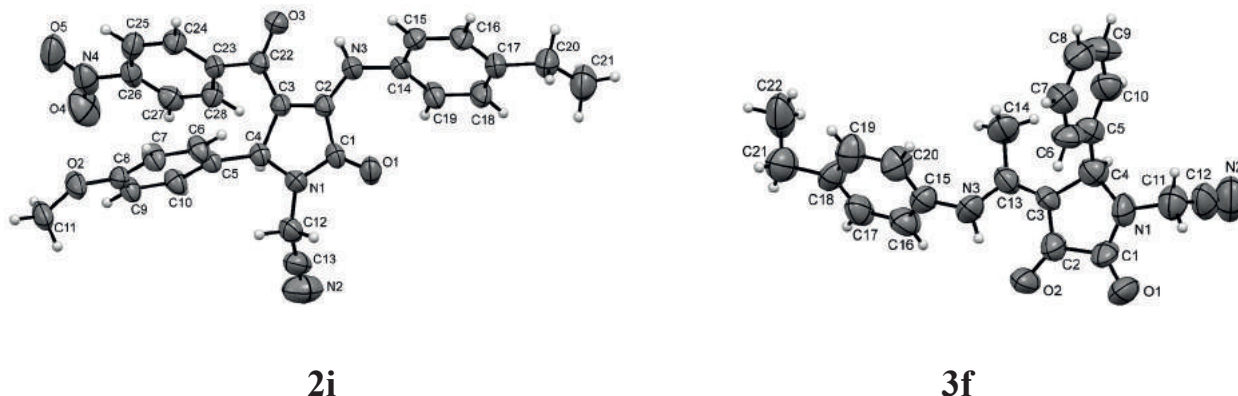


Рисунок. Общий вид молекул соединений **2i** и **3f** по данным РСА в тепловых эллипсоидах 50 % вероятности

Таким образом, в разных условиях с избытком ароматических аминов нами были получены 5-арил-3-ариламино-4-ароил-1-цианометил-3-пирролин-2-оны **2a-i**, 5-арил-4-(1-ариламиноэтилиден)-1-цианометил-тетрагидропиррол-2,3-дионы **3e** и **3f**, 5-фенил-4-[фенил(фениламино)метилен]-1-цианометилтетрагидропиррол-2,3-дион **3a** и 5-(4-метоксифенил)-4-[3-нитрофенил(4-этилфениламино)метилен]-1-цианометилтетрагидропиррол-2,3-дион **3d** (схема) для проведения скрининга на анальгетическую и противовоспалительную активность.

Список литературы

1. Машковский М. Д. Лекарственные средства. М.: РИА Новая волна, 2008. 1200 с.
2. Гейн В. Л., Булдакова Е. А., Король А. Н. и др. // ЖОХ. 2018. Т. 88, вып. 5. С. 764–768; Gein V. L., Buldakova E. A., Korol A. N. et al. // Russ. J. Gen. Chem. 2018. Vol. 88, № 5. P. 908–911.
3. Гейн В. Л., Булдакова Е. А., Дмитриев М. В. // ЖОХ. 2019. Т. 55, вып. 7. С. 1046–1054; Gein V. L., Buldakova E. A., Dmitriev M. V. // Russ. J. Organ. Chem. 2019. Vol. 55, № 7. P. 951–957.

УДК 547.822.3

А. Н. Верещагин, А. П. Минаева

Институт органической химии им. Н. Д. Зелинского РАН,
119991, Россия, г. Москва, Ленинский пр., 47,
anatoly103@yandex.ru

СИНТЕЗ И АНТИБАКТЕРИАЛЬНАЯ АКТИВНОСТЬ НОВЫХ ТЕТРАПИРИДИНИЕВЫХ СОЛЕЙ НА ОСНОВЕ ПЕНТАЭРИТРИТА*

Ключевые слова: четвертичные аммонийные соединения, антибактериальные агенты, пиридиниевые соли.

Четвертичные аммонийные соединения (ЧАС) широко используются в качестве антисептиков и дезинфицирующих средств. Среди ЧАС четвертичные пиридиниевые (в том числе бис-пиридиниевые) соли представляют собой важную группу химических веществ, широко используемых в качестве биоцидов, благодаря их сильному антимикробному действию даже в очень низких концентрациях на широкий спектр грамположительных и грамотрицательных бактерий, грибов и некоторых вирусов [1–3]. Одной из наиболее эффективных димерных пиридиниевых солей является октенидин дигидрохлорид **1** (рисунок) [4]. Недавно были получены димерные пиридиниевые соли **2** на основе