

СИНТЕЗ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ N-АКТИВИРОВАННЫХ АМИНОАЗИНОВ

Е.Д. Казакова¹, В.Д. Черенева¹, А.А. Мусихина^{1,2}, И.А. Утепова^{1,2,3},
О.Н. Чупахин^{1,3}, Г.Ф. Махаева⁴

¹ Уральский федеральный университет им. первого Президента России Б.Н. Ельцина,
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19;

² Южно-Уральский государственный университет, Челябинск, Россия
454080, г. Челябинск, проспект Ленина 76;

³ Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского, УрО РАН, 620990, Россия,
г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской/Академическая 20/22;

⁴ Институт физиологически активных веществ РАН, Черноголовка, 142432, Россия
г. Черноголовка, Северный проезд, д. 1.

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

Развитие методов селективного построения C-N связей является важным направлением в современном органическом синтезе, так как соединения, содержащие аминогруппы или их производные, проявляют биологическую активность широкого спектра и нашли свое применение в химической технологии и фармхимии [1].

Так, в результате проведенных исследований был получен ряд аминокпроизводных азидов, а также их активированных форм (N-оксидов, четвертичных солей). В качестве основного синтетического подхода был использован метод прямого окислительного аминирования азидов с вторичными аминами в присутствии комплекса $\text{AgPy}_2\text{MnO}_4$ в качестве окислителя (схема 1).

Так как активированные формы гетероаренов проявляют более высокую физиологическую активность в отношении нейродегенеративных заболеваний, в том числе и болезни Альцгеймера [2], было показано, что аминоказиды легко вступают в реакцию с йодистым метилом с образованием соответствующих N-метильных солей **4a** (схема 1).

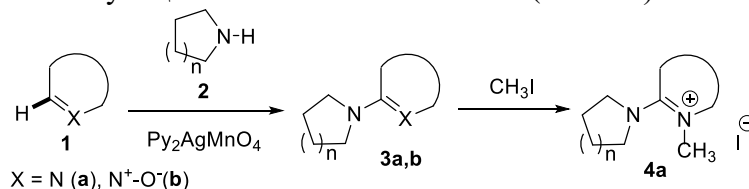


Схема 1. Синтез производных аминоказидов.

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

Было установлено, что аминоказиды, а также их активированные формы (N-оксиды, четвертичные соли) проявляют высокую антиоксидантную активность, сравнимую или превышающую активность стандартного антиоксиданта Тролокса.

Библиографический список

1. Corey E.J. Molecules and medicine / E.J. Corey, B. Czako, L. Kurti. – Hoboken, NJ. : John Wiley & Sons, 2007. – P. 272.
2. Pyrrolylquinoxaline-2-one derivative as a potent therapeutic factor for brain trauma rehabilitation / E.A. Dutysheva, M.A. Mikeladze, M.A. Trestsova [et al.] // Pharmaceutics. – 2020. – Vol. 12. – P. 414.

Работа выполнена при финансовой поддержке Российского научного фонда (грант № 22-13-00298).