

ка. По уравнению Штерна-Фольмера находили константу связывания и число связывающих центров. С помощью web-калькулятора «Molinspiration» рассчитывали ряд физико-химических констант соединений (площадь полярной поверхности, молекулярный объем, коэффициент распределения в системе «*n*-октанол-вода» ($\log P$)).

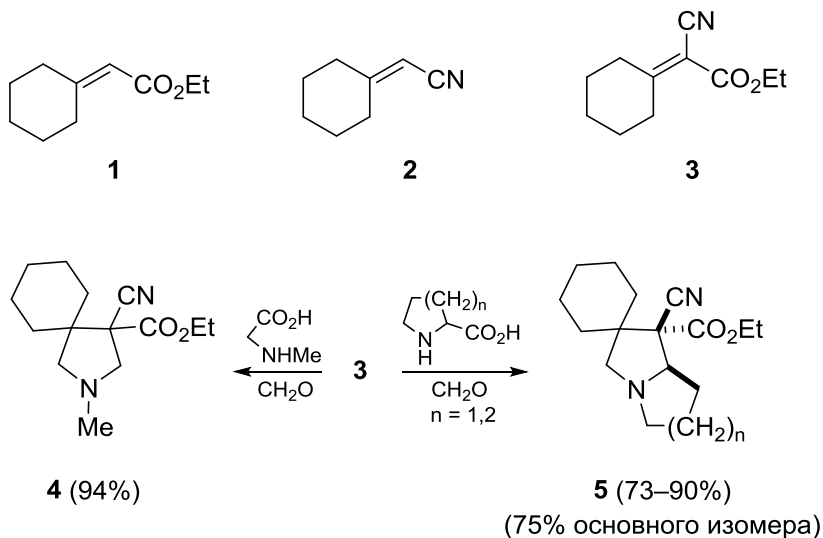
Установлено, что среди изученных физико-химических показателей наиболее выраженную корреляцию ($r=-0,59$, $p<0,001$) с антигликирующей активностью демонстрирует коэффициент $\log P$ – показатель соотношения липо- и гидрофильных свойств тиадиазинов. Большинство соединений являются активными ингибиторами гликирования, снижающими накопление фруктозамина в 1,5-2 раза по сравнению с контролем. Эти соединения имели значения $\log P$ в диапазоне 2,5-3,4. Полученные данные могут быть использованы при создании алгоритмов отбора соединений ряда 1,3,4-тиадиазина для испытаний на противодиабетическую активность.

[3+2] ЦИКЛОПРИСОЕДИНЕНИЕ ПРОИЗВОДНЫХ ЦИКЛОГЕКСИЛИДЕНУКСУСНОЙ КИСЛОТЫ С НЕСТАБИЛИЗИРОВАННЫМИ АЗОМЕТИН-ИЛИДАМИ

Павлушин А.В., Мошкин В.С., Сосновских В.Я.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

[3+2] Циклоприсоединение азометин-илидов является одним из самых удобных методов синтеза сложных азотсодержащих гетероциклов, ввиду доступности исходных соединений, простоты своего осуществления и свойственной ему высокой стереоселективности. В то же время, из-за малой устойчивости нестабилизированных азометин-илидов, их применимость значительно ограничена стерически открытыми диполярфилами. В связи с этим, в настоящей работе мы исследовали возможность их присоединения к производным циклогексиденуксусной кислоты, содержащей циклоалкильный заместитель при реагирующей двойной связи.



Было обнаружено, что этиловый эфир **1** и нитрил **2** образуют с нестабилизированными азотетин-идами только следы аддуктов [3+2] циклоприсоединения, в то время как акцепторности циклогексилиденциануксусного эфира **3** достаточно для успешного прохождения процесса. Взаимодействие цианоэфира **3** с саркозином и формальдегидом привело к ранее неизвестному пирролидину **4** с выходом 94%, а реакции с пролином и пипеколиновой кислотой с высокой регио- и стереоселективностью дали новые спиропирролизидины **5**.

РЕАКЦИИ 1,3-ДИПОЛЯРНОГО ЦИКЛОПРИСОЕДИНЕНИЯ 4-ЦИАНОФЕНИЛГИДРАЗОНОИЛХЛОРИДОВ С *N*-МЕТИЛ- И *N*-ФЕНИЛМАЛЕИМИДАМИ

Пахомчик В.Н., Попова А.В., Бельская Н.П.

Уральский федеральный университет
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19

Синтез пиразолинов является перспективным направлением химии гетероциклов, поскольку соединения, содержащие этот гетероциклический фрагмент, обладают широким спектром биологической активности и флуоресцентными свойствами [1].