

УД-32. СИНТЕЗ И АНАЛЬГЕТИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ ПРОИЗВОДНЫХ (Z)-4-(4-(ФУРАН-2-ИЛ)-2-МЕТИЛ-5-НИТРО-6-ФЕНИЛПИРИДИН-3-ИЛ)- 2-ГИДРОКСИ-4-ОКСОБУТ-2-ЕНОВОЙ КИСЛОТЫ

А. Л. Олещук¹, З. Т. Шульга², Т. Н. Криворучко², И. В. Кулаков³

¹ Омский государственный университет им. Ф. М. Достоевского,
644077, Россия, Омск, пр. Мира, 55а

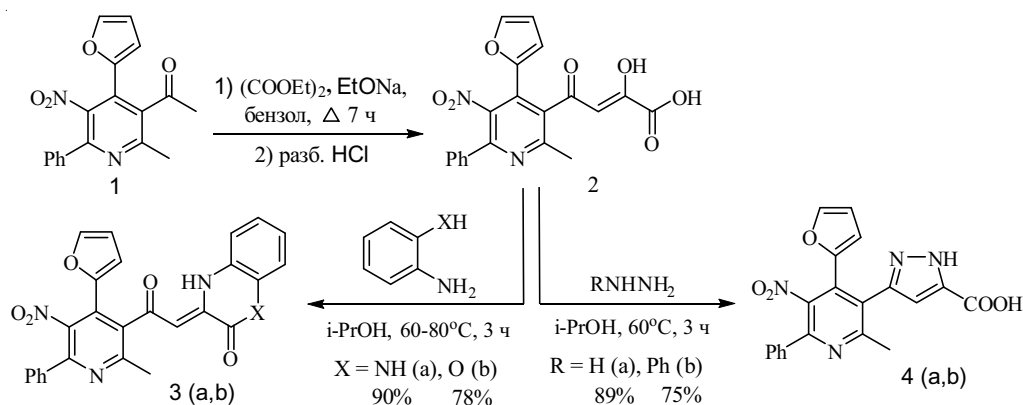
² Республиканское государственное предприятие
«Национальный центр биотехнологии»
Комитета науки Министерства образования и науки Республики Казахстан,
010000, Казахстан, Астана, Шоссе Кургальжинское, 13/5

³ Тюменский государственный университет, Институт химии,
625003, Россия, Тюмень, ул. Перекопская, 15а

E-mail: alyona.oleshchuk@yandex.ru

Производные карбонильных гетероциклов представляют особый интерес для органического синтеза, так как они являются удобными синтонами для получения производных ацилпировиноградных кислот – пиразола, 3,4-дигидрохинаксалин-2(1*H*)-она и 3,4-дигидро-1,4-бензоксазин-2(1*H*)-она и др. [1]. Подобные соединения заслуживают внимания в силу своих ярко выраженных биологических свойств [2, 3].

В связи с этим для нас представлял интерес синтез подобных соединений на примере малоизученного 3-ацетил-5-нитропиридина **1** [4]. Так, сложноэфирной конденсацией 3-ацетил-5-нитропиридина **1** с диэтилоксалатом была выделена соответствующая пиридиноил-2-гидрокси-4-оксибут-2-еновая кислота **2**, которая довольно легко под действием бинуклеофилов циклизуется в производные 3,4-дигидрохинаксалин-2(1*H*)-она **3 a, b**, 3,4-дигидро-1,4-бензоксазин-2(1*H*)-она **3 b** и пиразола **4 a, b**.



Для выявления анальгетической активности у синтезированных соединений были проведены биологические испытания на модели «уксусно-кислых корчей». В результате было установлено, что соединение **3 b** обладает активностью, сопоставимой с активностью анальгина. Остальные соединения обладают умеренно выраженной активностью.

Библиографические ссылки

1. Synthesis and pharmacological activity of heteroalpyruvic acid and their derivatives / T. N. Yanborisov [et al.] // Chem.-Pharm. journals. 1998. Vol. 32. P. 26–28.
2. Kulakov I. V. Synthesis and analgesic activity of bis(3,4-dihydroquinoxalin-2(1H)-one) and bis(3,4-dihydro-2H-1,4-benzoxazin-2-one) derivatives // Chemistry heterocycle. Compounds. 2017. Vol. 53. P. 1094–1097.
3. Soldatenkov A. T., Kolyadina N. M., Shendrik I. V. Basics of Organic Chemistry of Medicinal Substances. Moscow : Chemistry, 2001. 192 p.
4. Sagitullina G. P., Glizdinskaya L. V., Sagitullin R. S. Nitropyridines: IV. Synthesis of 3-(2-furyl)biphenyls by recyclization of nitropyridinium salts // Russ. J. Org. Chem. 2007. Vol. 43, № 4. P. 602–606.

Исследование выполнено при финансовой поддержке Комитета науки Министерства образования и науки Республики Казахстан (грант № AP05131602).