

3. Borodina O. S., Makarov G. I., Bartashevich E. V. et al. // Chemistry of Heterocyclic Compounds. 2019. Vol, 55. № 8. P. 755–761.

* Работа выполнена в рамках тем государственного задания АААА-А19-119011790134-1 с использованием оборудования Центра коллективного пользования ИОС УрО РАН «Спектроскопия и анализ органических соединений» (ЦКП «САОС»), а также при частичной финансовой поддержке РФФИ № 18-53-00026_Бел_а.

УДК 547.518+547.781.2

А. В. Басанцев, А. А. Данилин, П. П. Пурыгин

*Самарский национальный исследовательский университет
им. академика С. П. Королева (Самарский университет),
443086, Россия, г. Самара, ул. Московское шоссе, 34,
arsenal902009@rambler.ru*

СИНТЕЗ МОНО- И ДИАЛКИЛИРОВАННЫХ ПРОИЗВОДНЫХ ИМИДАЗОЛА НА ОСНОВЕ (АДАМАНТИЛ-1)БРОММЕТИЛКЕТОНА И ИССЛЕДОВАНИЕ ИХ АНТИКОАГУЛЯЦИОННОЙ И АНТИАГРЕГАЦИОННОЙ АКТИВНОСТИ

Ключевые слова: имидазол, *N*-алкилирование, (адамантил-1)бромметилкетон, антикоагуляционная активность, антиагрегационная активность.

Различные методы получения *N*-моно- и *N,N*-диалкилированных производных имидазола представляют определенный интерес не только для органической химии, но и для фармакологии. Наличие адамантоилметильной группы в структуре азотистых пятичленных гетероциклов позволяет также рассматривать данные соединения в качестве потенциальных биологически активных веществ, обладающих выраженными противовирусными свойствами [1, 2].

N-моноалкилированные имидазолы широко используются не только в виде промежуточных синтонов для синтеза современных лекарственных препаратов, но и сами могут обладать выраженной биологической активностью, например противомикробной [3] и противоэпилептической [4]. Известно, что четвертичные соли имидазолия могут обладать антикоррозионной активностью [5], а также способны проявлять противоопухолевые свойства [6] из-за

содержания длинноцепочечных углеводородных цепей, обладающих гидрофобностью.

Исходя из актуальности исследования [7, 8], нами был получен ряд моно-**1a-1d** и диалкилированных **2a-2d** производных имидазола (табл. 1):

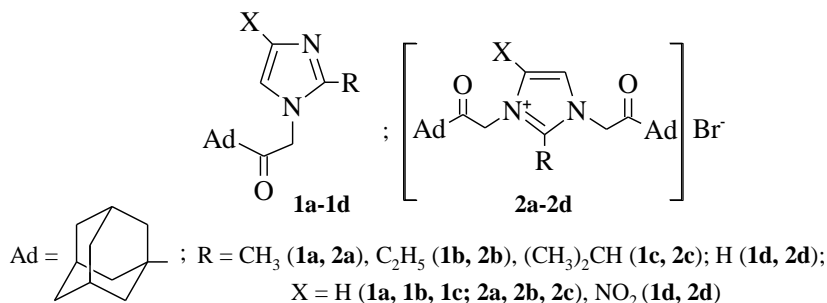


Таблица 1

Характеристические данные полученных соединений

Соединение	Условия реакции	Выход, %	Т. пл., °С	
1a	NaH, ГМФТА, 20°C, 12 ч	60	203-205	
1b		28	200-201	
1c		–	(масло)	
1d		77	253-255	
2a	CCl ₄ , 5 ч	20°C	41	370
2b			70	375
2c		кипячение	60	350
2d			13	330-332

Определение антикоагуляционной и антиагрегационной активности соединений **1a, 1b, 1d, 2a, 2b, 2d** было осуществлено согласно методике [9].

Таблица 2

Влияние впервые синтезированных соединений и препаратов сравнения на показатели агрегации тромбоцитов

Соединения	Скорость агрегации к контролю, %
1a	-2,9 (2,1-4,3)
1b	-23,2 (22,1-26,7)
1d	-1,6 (1,4-2,3)
2a	-2,9 (2,1-4,3)
2b	-23,1 (21,4-25,7)
2d	-21,9 (18,5-23,6)
Аспирин	-10,5 (7,6-12,3)
Эуфиллин	-21,4 (18,7-23,2)

Установлено, что все соединения, представленные в табл. 2, проявили антикоагуляционную и антиагрегационную активности (**1b** и **2d** более 10 %).

Список литературы

1. Shiryayev V. A., Radchenko E. V., Palyulin V. A. et al. // Eur. J. Med. Chem. 2018. Vol. 158. P. 214-235.

2. *Makarova N. V., Boreko E. I., Moiseev I. K. et al.* // Pharm. Chem. J. 2001. Vol. 35, № 6. P. 308–311.
3. *Popov A. F., Piskunova Z. P., Matvienko V. N. et al.* // Pharm. Chem. J. 1989. Vol. 23, № 10. P. 847–849.
4. *Walker K. A. M., Wallach M. B., Hirschfeld D. R.* // J. Med. Chem. 1981. Vol. 18, № 1. P. 7–74.
5. *Журавлев О. Е., Ворончихина Л. И.* // Современные проблемы науки и образования. 2008. Вып. 6. С. 70.
6. *Malhotra S. V., Kumar V.* // Bioorg. Med. Chem. Lett. 2010. Vol. 20, № 2. P. 581–585.
7. *Pittala V., Salerno L., Romeo G. et al.* // Curr. Med. Chem. 2013. Vol. 20, № 30. P. 3711–3722.
8. *Rahman M. N., Vlahakis J. Z., Szarek W. A. et al.* // J. Med. Chem. 2008. Vol. 51, № 19. P. 5943–5952.
9. *Самородов А. В., Баширова Л. И.* Изучение антикоагуляционной и антиагрегационной активности в условиях *in vitro* впервые синтезированных веществ. Уфа, 2019.

УДК 547

Д. В. Беляев¹, Д. Л. Чижов¹, Г. Л. Русинов^{1,2},
В. Н. Чарушин^{1,2}

¹Институт органического синтеза
им. И. Я. Постовского, УрО РАН,
620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской / Академическая, 20 / 22,
²Уральский Федеральный Университет
им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19,
D734698@yandex.ru

РЕАКЦИИ ДИМЕТИЛАЦЕТАЛЕЙ 3-(ПОЛИФТОРАЦИЛ)ПИРУВАЛЬДЕГИДОВ С АМИНАМИ*

Ключевые слова: диметилацетали, 3-(полифторацил)пирувальдегид.

Фторсодержащие 1,3-дикарбонильные соединения являются важными реагентами для получения разнообразных пяти-, шестичленных гетероциклических соединений, лигандов для координационной химии, аналитических реагентов.

Недавно нами были предложены новые строительные блоки – диметилацетали 3-(полифторацетил)пирувальдегидов **1a,b**. В настоящей работе была изучена реакционная способность **1a,b** при взаимодействии с анилином,