

СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ ПОХІДНИХ БІЦИКЛІЧНИХ АМІНІВ ТА НАФТАЛЕВИХ АНГІДРИДІВ

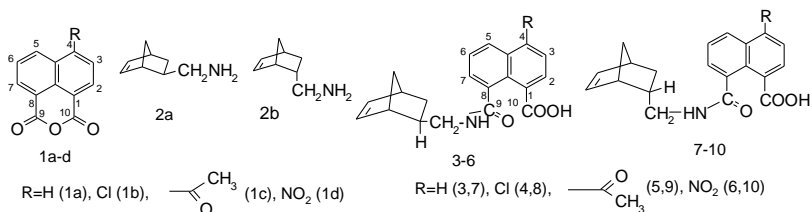
Крищик О. В., Коноваленко Л. С.

ДВНЗ «Український державний хіміко-технологічний університет», Дніпро, Україна
oxanakp15@gmail.com

Біологічна дія каркасных амінів визначається великим об'ємом і значною ліпофільністю молекул. Відомо, що сульфонаміди ряду норборнена і норборнана мають анальгетичну, протисудомну, протизапальну, транквілізуючу, антигіпоксичну дію.

Можна було очікувати, що використання амінів з фармакофорними каркасами норборнена і норборнана сприятливо позначиться на біологічній активності сполук.

Нами були досліджені реакції біциклічних амінів з нафталевим ангідридом (1a) і заміщеними нафталевими ангідридами: 4-хлорнафталевим (1b), 4-ацетил (1c) і 4-нітронафталевим (1d) ангідридами. У якості амінів використовували екзо- і ендо-аміни (2a, b). Синтез проводили в бензолі при кімнатній температурі при перемішуванні. Амін (2a) утворював амідокислоти (3-6); амін (2b) – амідокислоти (7–10).



В ІЧ-спектрах синтезованих амідокислот спостерігається поглинання карбоксильної і вторинної амідної груп в областях 3400–3350, 3245–3220, 1700–1676, 1650–1628, 1580–1550 cm^{-1} (ν_{OH} , ν_{NH} , $\nu_{\text{C=O}}$, δ_{NH}). Для спектрів сполук (5, 9) характерні смуги поглинання ацетильної групи (1702, 1709 cm^{-1}), в спектрах амідокислот (6, 10) спостерігається поглинання нітрогрупи (1546 і 1362, 1527 і 1360 cm^{-1}).

Спектри ЯМР¹H амідокислот підтверджують структуру отриманих сполук. Так протони олефінового фрагмента екзо-ізомерів близькі за хімізсувом, а в разі ендо-ізомерів істотно нееквівалентні.

Можливість альтернативного реагування ангідридів (1b–d) по карбонільним групам при C₉ і C₁₀ досліджена з використанням квантовохімічного розрахунку молекул напівемпіричним методом AM1. Результати розрахунку показали, що нітрогрупа на відміну від атома хлору та ацетильної групи значно перерозподіляє електронну густину на атомах C₉ і C₁₀, при цьому спостерігається істотне ослаблення зв'язку C₉–O і зростання міцності альтернативного зв'язку C₁₀–O. Це сприяє атаці амінів по атому C₉ з розривом зв'язку C₉–O і утворенню регіоізомерів.