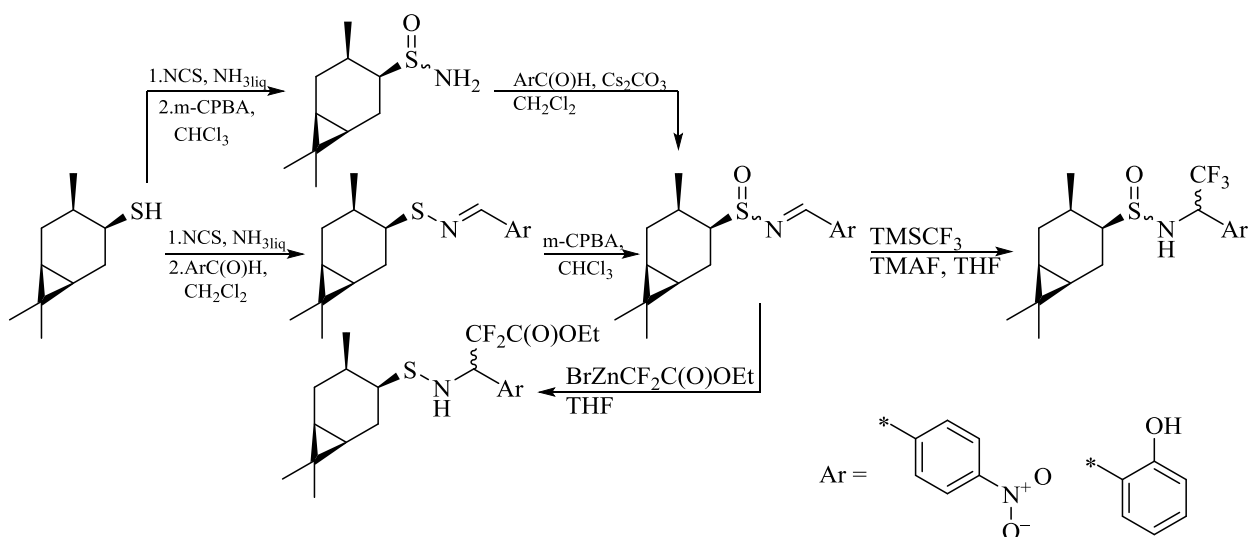


## Лаборатория химии окислительных процессов важнейшие 2018

### **1. Осуществлен синтез и оценена противомикробная активность фторсодержащих аминопроизводных на основе 4-карантиола**

Амидирование и реакции конденсации 4-карантиола с 4-нитробензальдегидом и салициловым альдегидом приводит к сульфениминам с выходами 73–99%. Проведено их асимметрическое окисление хиральными и ахиральными окислительными системами (m-CPBA, ТВНР, СНР/VO(acac)<sub>2</sub>, H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>/L\*/VO(acac)<sub>2</sub>) с образованием сульфениминов. Нами предложен удобный способ синтеза хиральных первичных сульфенимидов из 4-карантиола в одну стадию. Реакция конденсации сульфенимидов с салициловым альдегидом и 4-нитробензальдегидом приводит к соответствующим сульфениминам. N-замещенные трифторметилсульфенимиды получены путем присоединения фторсодержащего реагента Рупперта-Пракаша к сульфениминам. Проведено присоединение фторсодержащего реагента Реформатского к полученным сульфениминам с образованием N-замещенных фторсодержащих сульфенимидов. Оценена противомикробная активность полученных соединений. Согласно результатам испытаний, фторсодержащие сульфенимиды и некоторые сульфенимины показали антибактериальную активность в отношении *Acinetobacter baumannii*, а также противогрибковую активность в отношении *Candida albicans*. Сульфенимины обладают способностью защищать эритроциты теплокровных в условиях окислительного стресса *in vitro*.



Исполнители: м.н.с., Крымская Ю.В., аспирант Ильченко Н.О., с.н.с., к.х.н.  
Судариков Д.В.

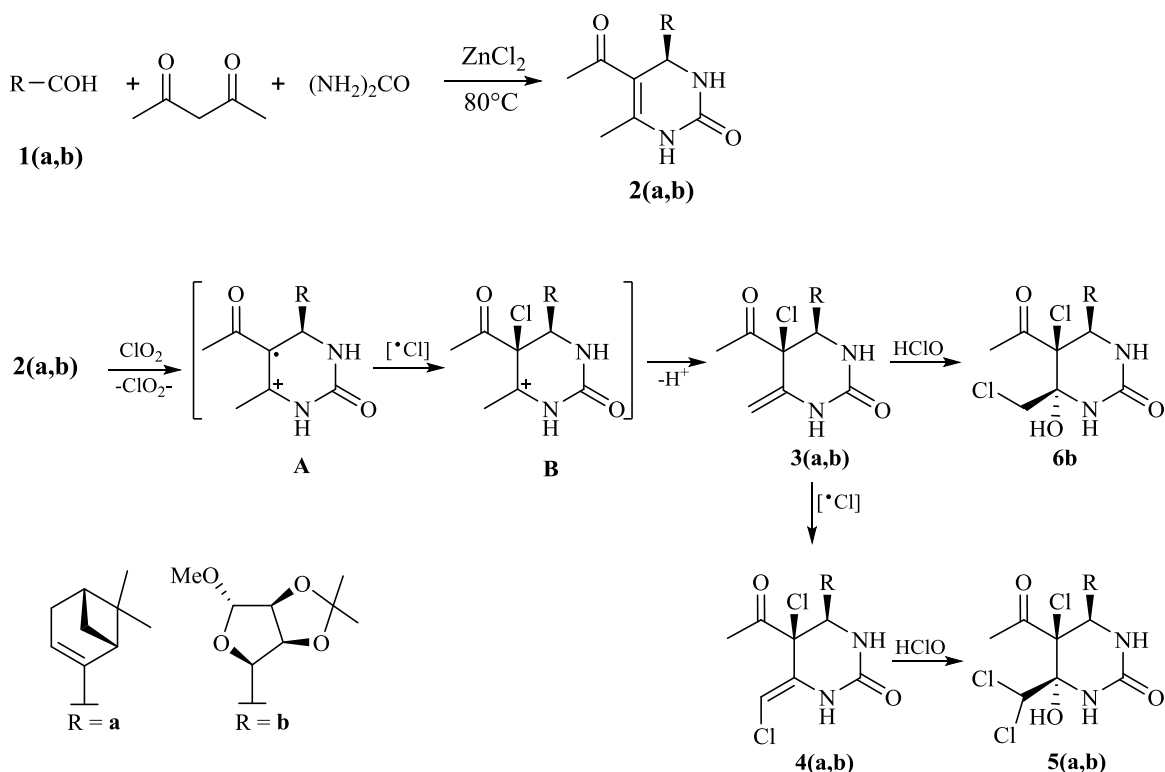
Институт химии Коми НЦ УрО РАН

Лаборатория химии окислительных процессов:

Зав. лаб. д.х.н. Рубцова С.А.

1. Изв. АН. Сер. хим., 2018, № 4, с.731-742. doi:10.1007/s11172-018-2130-7.
2. Патент РФ, № RU2650681 (C1).
3. Патент РФ, № RU 2646959 (C1).

**2. Осуществлен асимметрический синтез хиральных 3,4-дигидропиримидинов с миртенильным и 1-*O*-метил-2,3-*O*-изопропилиден- $\alpha$ -*L*-эритрофуранозным фрагментами и исследованы их реакции с диоксидом хлора в различных условиях.**



Впервые осуществлен асимметрический синтез хиральных гетероциклов 3,4-дигидропиримидинового типа **2(a,b)**, содержащих в положении  $C^4$  миртенильный **a** и 1-*O*-метил-2,3-*O*-изопропилиден- $\alpha$ -*L*-эритрофуранозный **b** фрагменты. Выявлено, что хлорирование полученных соединений  $ClO_2$  протекает стереоселективно и зависит от природы заместителя при  $C^4$ , типа растворителя и времени реакции. Установлено, что использование эквимольного количества диоксида хлора в большинстве случаев приводит к тем же самым продуктам, что и его избыток, однако конверсия исходных гетероциклов **2(a,b)** не превышает 40%. Добавление двух эквивалентов диоксида хлора способствует увеличению конверсии до 95% и, соответственно, увеличению выхода конечных продуктов. В среде

ацетонитрила или пиридина селективно при действии  $\text{ClO}_2$  образуются монохлорированные по  $\text{C}^5$  продукты **3(a,b)**, тогда как в хлороформе, в зависимости от способа подачи  $\text{ClO}_2$  и времени реакции, – только ди- и трихлорированные соединения **4–6**.

*Исполнители: н.с., к.х.н. Изместьев Е.С., н.с., к.х.н. Пестова С.В.*

*Институт химии Коми НЦ УрО РАН*

*Лаборатория химии окислительных процессов:*

*Зав. лаб. д.х.н. Рубцова С.А.*

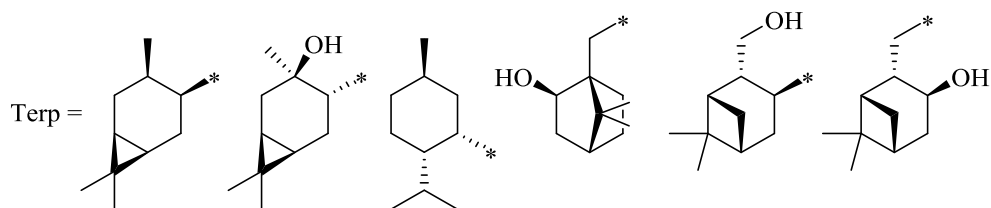
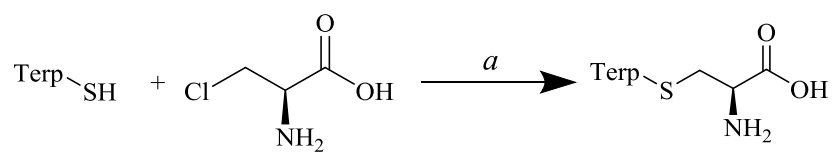
3. Разработка экологически безопасных методов выделения, очистки и модификации компонентов сульфатного скипидара для получения оптически активных полифункциональных терпеноидов с физиологически активными свойствами.

*Регистрационный номер: АААА-А18-118012490165-6*

*Рук. Д.х.Н. Рубцова С.А.*

**Осуществлен синтез и оценена цитотоксичность, антиоксидантная и мембранопротекторная активности новых S-монотерпенилцистеинов**

Синтезированы новые S-монотерпенилцистеины на основе 4-карантиола, 3-гидроксиизокарантиола, неоментантиола, 10-тиоизоборнеола, 10-гидроксиизокамфенилтиола, 10-тиоизокамфеола, не проявившие цитотоксичность по отношению к эритроцитам крови лабораторных мышей (10 мкмоль/л), и обладающие статистически значимой мембранопротекторной и антиоксидантной активностью (50 мкмоль/л). В этой связи представляет интерес дальнейшее детальное изучение свойств полученных соединений, в частности, наличие противомикробной, антидиабетической, нейропротекторной и других видов активностей на различных биологических моделях.



*a.* NaH, ДМФА, 0°C → комн. темп.

1. *Chem. Nat. Compd.* **2018**, 54, 281–285.

2. Патент РФ №RU 2675238(C1).