

**Балика А.В., Макей О.П., Янченко В.О.**

*Національний університет «Чернігівський колегіум» імені Т. Г. Шевченка*

## **СИНТЕЗ НОВИХ ПОХІДНИХ НА ОСНОВІ 3-ЗАМІЩЕНИХ-1-ЦІАНОАЗЕТИДИНІВ**

У ході експериментальних досліджень було здійснено синтез похідних на основі 3-заміщених-1-ціаноазетидинів.

In the course of experimental studies, derivatives based on 3-substituted-1-cyanoazetidines were synthesized.

**Ключові слова:** заміщений-1-ціаноазетидин

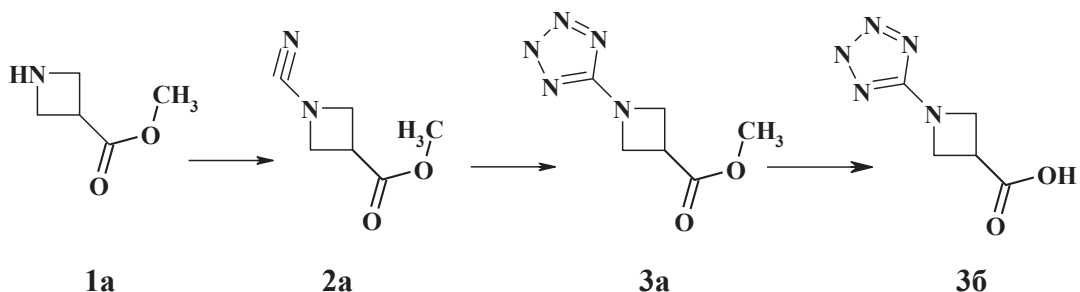
Нітрогеновмісні насичені гетероцикли (азетидин, піролідин, піперидин) є важливими структурними одиницями серед лікарських засобів, біологічно активних молекул і природних сполук. Їх синтез та подальша модифікація залишається одним із напрямків синтетичних хімічних досліджень [1,2].

Протягом багатьох років азетидини та 2-азетидинони вважаються корисними субстратами в органічній хімії для синтезу біологічно активних молекул за рахунок функціональності в різних положеннях кільця. Тому вони привернули увагу у галузі не лише органічного синтезу, а і прикладних досліджень, зокрема фармацевтичного та медичного напрямків.

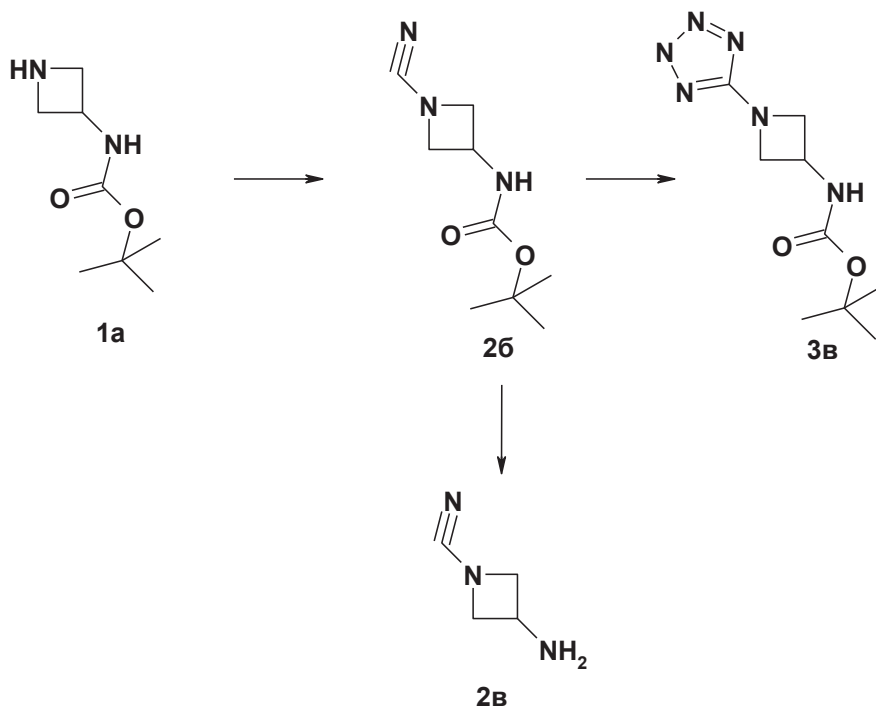
На сьогодні інтерес до азетидину та його похідних зростає, оскільки вони мають різноманітні фармакологічні властивості. Повідомляється, що похідні азетидину демонструють протимікробну, протитуберкульозну, протисудомну, протизапальну, протималярійну, протипухлинну, протівірусну, антиоксидантну дію [1,2]. Також вони корисні для лікування розладів центральної нервової системи, такі як хвороба Альцгеймера, шизофренія, депресія, психоз, тривога тощо. Молекули, що містять азетидинове кільце, помітно активні проти вірусу грипу А H2N2.

Складність дослідницької роботи з похідними азетидину полягає у незначній кількості інформаційних даних щодо методів синтезу та хімічних властивостей у фахових виданнях. Також, варто відмітити, що азетидин характеризується високою енергією кільцевої деформації, і, як наслідок, це викликає складнощі та проблеми у хімічних перетвореннях та біосинтезі, що може пояснити обмежену кількість природних продуктів, що містять азетидин.

Згідно першої схеми було отримано ряд похідних азетидину. Зокрема, на першій стадії на основі азетидину **1a** при дії фенілціанату вдалося отримати ціанамід **2a** з виходом 78%. Друга стадія – утворення тетразолу **3a** була проведена за участю натрій азиду. На третій стадії відбувся гідроліз естерної групи з виділенням кислоти **3b**.



На наступному етапі дослідження у якості вихідної сполуки було використано трет-бутилазетидин-3-ілкарбамат **16**. Перша стадія супроводжува-лась отриманням з високим виходом N-ціаноазетидину **26**, який надалі під дією гідроген хлориду було позбавлено БОК-захисту. В результаті отримали амін **2в** у формі дигідрохлориду.



Однак спроба перетворення N-ціаноазетидину **26** на відповідний тетразол **3в** не була вдалою, оскільки в умовах проведення перетворень азетидиновий цикл зазнавав деструкції. Тому очікуваний тетразол **3в** було ідентифіковано у незначній кількості лише у залишкових кількостях у виділеній після хімічної взаємодії суміші.

Дослідження були виконані з використанням потужностей ТОВ НВК «Укроргсинтез».

### Список використаних джерел

1. Xu J., McClory A., Mack K., Dalziel M. Efficient Manufacturing Process for the Selective Estrogen Receptor Degrader GDC-9545 (Giredestrant) via a Crystallization-Driven Diastereoselective Pictet–Spengler Condensation. *Organic Process Research and Development*. 2022. Vol. 26, № 3, P. 568–582.
2. Alpha 1A adrenergic receptor antagonist: пат. 6,143,750 США: Int. Cl. A61K 31/505, U.S. Cl. 514/258. № US06143750; заявл. 17.07.98; опубл. 07.11.2000, 52 с.

УДК 579.63

Близнюк О. М.<sup>1</sup>, Ніколаснко В. О.<sup>1,2</sup>, Москаленко О.В.<sup>1,2</sup>

<sup>1</sup>ТОВ «НАТА ГРУП» м. Ніжин, Україна

<sup>2</sup>Ніжинський державний університет імені Миколи Гоголя, м. Ніжин, Україна

### ВИВЧЕННЯ ВІРУЛІЦИДНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ ПРЕПАРАТУ «СУРФАЦИД-НАТА»

Досліджено віруліцидні властивості засобу «Сурфацид-НАТА». Встановлено, що препарат «Сурфацид-НАТА» у концентрації 0,05% та експозиції 60 хвилин призводить до інактивації вірусу поліомієліту. Доведено, що препарат «Сурфацид-НАТА» за своєю віруліцидною активністю задовольняє вимогам, щодо його використання у закладах охорони здоров'я для проведення всіх видів дезінфекційної обробки.

**Ключові слова:** віруліцидна активність, дезінфекційний засіб, Сурфацид-НАТА.

The virulicidal properties of Surfacid-NATA were studied. It was established that the drug "Surfacid-NATA" in a concentration of 0.05% and an exposure of 60 minutes leads to the inactivation of the poliomyelitis virus. It has been proven that the drug "Surfacid-NATA" meets the requirements for its use in health care facilities for all types of disinfection treatment due to its virulicidal activity.

**Key words:** virucidal activity, disinfectant, Surfaccine-NATA.

Сучасні дезінфекційні засоби повинні володіти антимікробною та віруліцидною активністю, низькою токсичністю та алергенністю. Широкий сектор медичного обладнання потребує використання дезінфекційних засобів, що володіють особливими експлуатаційними властивостями, а саме: низькою корозійною активністю, низьким рівнем піноутворення, стабільністю робочих розчинів, тощо.