НОВЫЙ ПОДХОД К ПОЛУЧЕНИЮ АНТИ-ВИЧ АКТИВНЫХ ПРОИЗВОДНЫХ 5-АЛКИЛ-2-АЛКОКСИ-6-БЕНЗИЛПИРИМИДИН-4(3Н)-ОНА

И.А. Кириллов¹, И.А. Новаков¹, М.Б. Навроцкий¹, D. Schols², П.П. Дешевов¹

¹ФГБОУ ВО Волгоградский государственный технический университет,
400005, Российская Федерация, Волгоград, пр. им. Ленина, 28.

²Рега институт медицинских исследований,
B1030 3000, Бельгия, Лёвен, ул. Миндербродерстрат, 10.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-246

E-mail: kirillow.vania@yandex.ru

В продолжение работ [1] по направленному конструированию блокаторов ретровирусной репликации ряда производных DABO была впервые показана возможность получения этих соединений с использованием реакции алкоголиза производных *N*²-нитроизоцитозина в условиях катализа третичным амином, не описанная ранее в литературе. Соответствующие превращения иллюстрируются следующей схемой реакции:

где Alk = *i*-Pen, *n*-Bu, *i*-Bu, *c*-Pen; Ar = 2,6-F₂-C₆H₃, 2,6-Cl₂-C₆H₃, 2-F-6-Cl-C₆H₃, 3,5-Me₂-C₆H₃;
R = Me, MeO; R' = H; R+R'=(CH₂)₂

Было установлено, что в случае первичных алифатических спиртов, а также циклоалканолов эта реакция становится основной и приводит к образованию соответствующих производных 2-алкоксипиримидин-4(3Н)-она. Использование разветвленных вторичных спиртов приводит к образованию производного урацила.

Полученные впервые соединения были подвергнуты исследованию в отношении ВИЧ-1/2 в условиях острого эксперимента *in vitro*. Данные соединения показывают сопоставимую и более высокую активность в отношении ВИЧ-1, чем препараты сравнения, однако уступают им по анти-ВИЧ-2 активности. Структура и чистота полученных соединений доказаны с использованием современных физико-химических методов анализа.

Литература

- [1]. И.А. Новаков, Л. Л. Брунилина, А.А. Вернигора, И.А. Кириллов, А. С. Мкртчян, М. Б. Навроцкий, Д. С. Шейкин, А. С. Яблоков, Е. А. Ручко, В. В. Качала. Аминолиз 6-[1-(2,6-дифторфенил)циклопропил]-5-метил-2-(нитроамино)пиримидин-4(3Н)-она // Журнал органической химии. – 2017. – Т. 53, № 12. – С. 1808-1815.