

# СИНТЕЗ НОВИХ ПОХІДНИХ 1,3-ІНДАНДІОНУ

Вінник А. О.<sup>1</sup>, Пантилеева Ю. В.<sup>1</sup>, Замігайло Л. Л.<sup>2</sup>, Колос Н. М.<sup>1</sup>

<sup>1</sup> Харківський національний університет імені В.Н. Каразіна

<sup>2</sup> Харківський національний медичний університет

Alla\_vinnik@mail.ru

Відомо, що деякі похідні 1,3-індандіону, зокрема, фенілін і метиндіон, є антикоагулянтами непрямой дії, які пригнічують синтез факторів згортання крові в печінці, наприклад, протромбіну. Ці препарати використовують для тривалої профілактики венозних тромбозів та тромбоемболітів.

Метою даної роботи став синтез нових похідних спіропіримідину при проведенні трикомпонентної конденсації за участю 1,3-індандіону, арилглюксалів та сечовин.

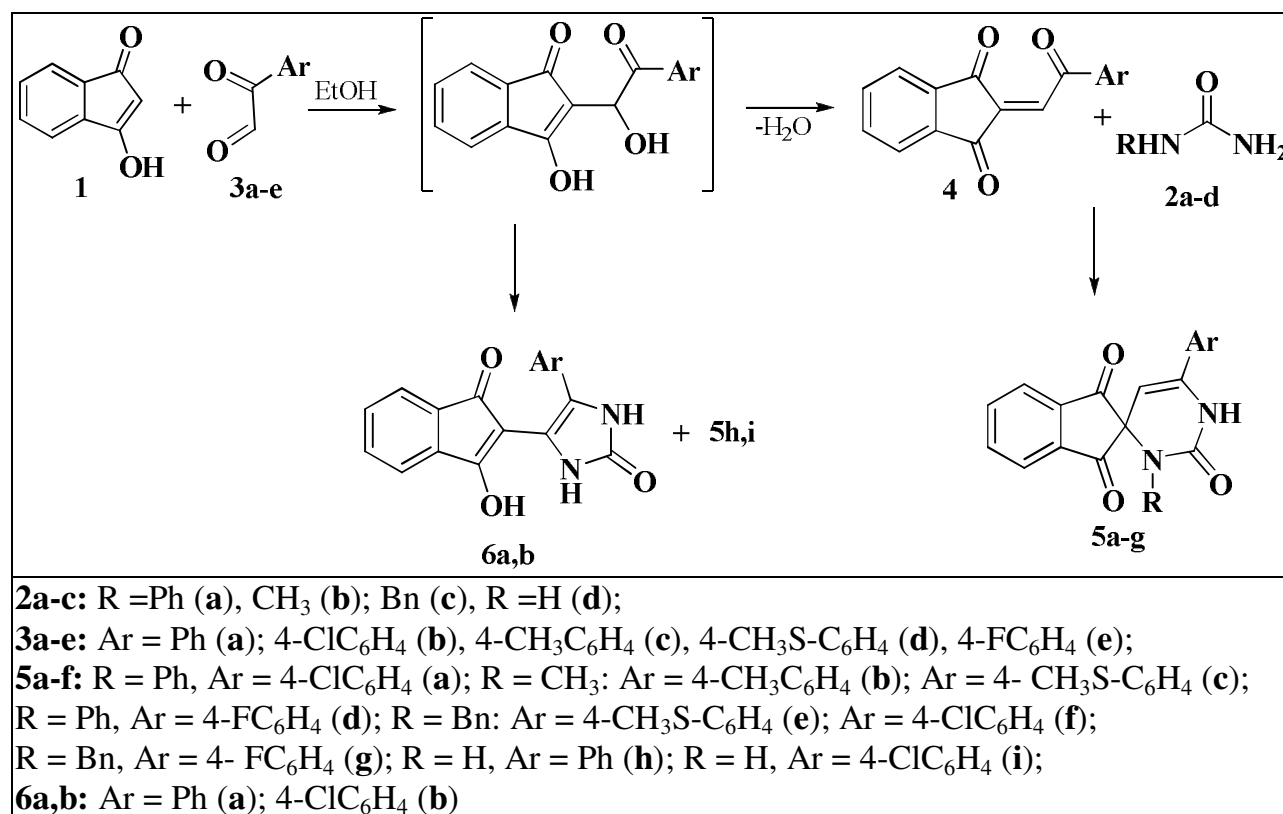


Схема синтезу спіропіримідинонів

Встановлено, що у випадку однореакторної взаємодії β-дикетону **1**, N-заміщених сечовин **2a-b** та арилглюксалів **3a-c** утворюються відповідні спіропіримідини **5a-g** з високими та задовільними виходами, тоді як в реакції з сечовиною, в аналогічних експериментальних умовах, виділено суміші спіропіримідинів **5** і імідазолів **6**. Синтез останніх можна пояснити уповільненням стадії дегідратації інтермедіата **A** в фенациліденопохідне **4**. У випадку ж N-арилсечовин нуклеофільність азотовмісних реакційних центрів знижена, тому стадія елімінування передуює нуклеофільній атаці, що сприяє утворенню спіропіримідинів **5**. Ця гіпотеза підтверджена взаємодією

попередньо виділеного фенациліденпохідного **4a** з сечовиною. Продуктом реакції виявився спіропіримідини **5h** без домішку імідазолін-2-ону **6a**.

Будова вперше синтезованих сполук підтверджена ЯМР<sup>1</sup>H, мас-спектрами та даними елементного аналізу. Для ряду отриманих сполук проведено віртуальний скринінг фармакологічної активності за програмою PASS.