

## ХІМІЧНІ НАУКИ

**Полюдов А.О.**

*магістрант,*

*Національний технічний університет України*

*«Київський політехнічний інститут імені Ігоря Сікорського»*

*Науковий керівник: Добридень О.В.*

*кандидат хімічних наук, науковий співробітник*

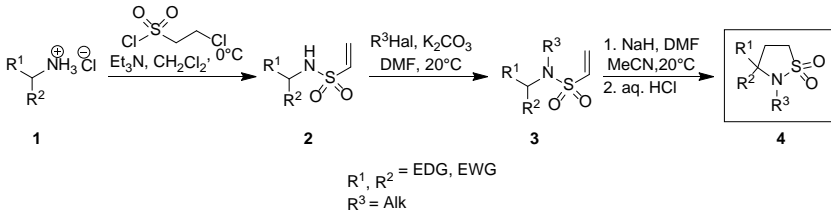
*НВП «УКРОРГСИНТЕЗ»*

### **1,1 – ДІОКСОІЗОТІАЗОЛІДИНИ – МЕТОДИ СИНТЕЗУ ТА ПЕРСПЕКТИВИ ВИКОРИСТАННЯ**

Існує велика кількість високоефективних лікарських засобів, до складу яких входить сульфонамідна функціональна група. Це є нестероїдні протизапальні засоби (лорноксикам, цефекоксиб), сечогінні засоби (фуросемід, гідрохлортіазид), сульфаніламідні протимікробні препарати, які є похідними *n*-амінобензенсульфонаміду.

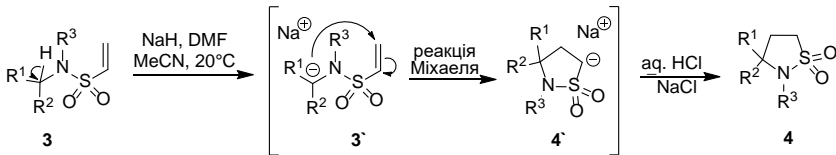
Останнім часом в якості основних методів синтезу циклічних сульфамідів – сультамів, розглядають реакції Міхаеля, Бейліс – Хіллмана, Паусона – Ханда та внутрішньомолекулярний метатезис. У даній роботі було розглянуто отримання 3,3-дизаміщених похідних 1,1-діоксоізотіазолідину. Оптимальним методом отримання даних сполук є використання реакції Міхаеля через відносно просту схему синтезу, легкість отримання вихідних речовин (наприклад, природні амінокислоти) та відносно невисоку собівартість отриманного продукту.

Синтез проводиться за нижченаведеною Схемою 1. Вихідна речовина **1** при охолодженні вступає в реакцію з 2-хлороетансульфонілхлоридом у присутності триетиламіну в середовищі дихлорометана з утворенням речовини **2**. Подальшим алкілуванням речовини **2** за допомогою алкілгалогеніду з використанням у якості основи карбонату калію у середовищі *N,N*-диметилформаміду при кімнатній температурі було отримано речовину **3**. Остання в присутності основи у системі ацетонітрил – *N,N*-диметилформамід при кімнатній температурі перетворюється на цільову сполуку **4**.



### Схема 1. Отримання 3,3-дизаміщених сульфамідів

Механізм проходження циклізації представлено на Схемі 2.



### Схема 2. Механізм внутрішньо молекулярної реакції Міхаеля

Сполуки, описані вище, можуть знайти своє використання у медичній хімії як високоефективні біозостерні еквіваленти вже добре відомим лактамам, які входять до складу  $\beta$ -лактамних антибіотиків (цефтріаксон, пеніцилін тощо). Синтетично просте отримання таких сульфамідів сприяє розвитку медичної хімії та відкриттю нових високоефективних лікарських засобів.