

4. Спиридонов А.А. Планирование эксперимента при исследовании технологических процессов. - М.: Машиностроение, 1981. - 184 с.

2-аминозамещенные пиримидин-4(3H)-оны и 1,2,4-триазин-5(4H)-оны как потенциальные биологически активные соединения

Сим О.Г., Новиков М.С., Озеров А.А.

Кафедра фармацевтической и токсикологической химии Волгоградского государственного медицинского университета

С целью поиска новых биологически активных веществ в ряду гетероциклических соединений нами был осуществлен синтез 2-аминопроизводных пиримидин-4(3H)-она и 1,2,4-триазин-5(4H)-она. Синтез 5-замещенных 6-метилицитозинон и 6-азацитозинон, замещенных по экзоциклическому атому азоту был проведен путем аминолита соответствующих производных 6-метил-2-(этилтио)-4(3H)-пиримидинона и 3-(этилтио)-1,2,4-триазин-5(4H)-она. Важным фактором, лимитирующим скорость реакции аминолита, является основность амина, выраженная через pK_a сопряженной ему кислоты. Нами было показано, что реакция с высокоосновными аминами, имеющими pK_a сопряженной кислоты 10 и выше, протекает уже при кипячении исходного этилтиопроизводного в избытке соответствующего амина за 5-10 ч. С понижением основности амина, а также при переходе от первичных аминов ко вторичным, скорость реакции аминолита существенно снижается, поэтому полная конверсия исходного этилтиопроизводного требует увеличения времени реакции до 16 ч. Положительно влияет на протекание реакции в данном случае применение в качестве соразтворителя 2-этоксигэтанол, обладающего высокой диэлектрической проницаемостью.

При проведении реакции аминолита 2-(этилтио)урацилов низкоосновными ароматическими аминами (анилин, метоксианилины и др.) при кипячении в течение многих часов с избытком амина выделить целевые продукты не удалось. Это явление обусловлено низкой основностью и реакционной способностью соответствующих аминов. Проведение данной реакции в присутствии соразтворителя также не дало положительных результатов. В связи с указанными трудностями, для синтеза производных 2-(ариламино)-4(3H)-пиримидинона нами была применена двустадийная схема синтеза. На первой стадии исходное этилтиопроизводное было превращено в этилсульфонильное производное путем окисления раствором пероксида водорода в водной уксусной кислоте. В полученном таким образом соединении присутствует этилсульфонильная группа, легче замещающаяся амином в силу невысокой прочности её связи с гетероциклическим ядром, обусловленной электронными эффектами. На второй стадии синтеза полученное производное 2-(этилсульфонил)-4(3H)-пиримидинона было подвергнуто аминолиту соответствующим ароматическим амином.

Индивидуальность 40 новых производных, не описанных ранее в литературе, была установлена методом тонкослойной хроматографии. Структура синтезированных веществ была подтверждена методом ЯМР- H^1 спектроскопии и масс-спектрометрией.

Таким образом, в результате проведенных исследований нами был разработан процесс аминирования 2-(этилтио)производных пиримидин-4(3H)-она и 1,2,4-триазин-5(4H)-она, приводящий к новым 2-аминопроизводным с прогнозируемой антибактериальной активностью.

Рентгенографическое исследование сплавов тербий-магний с р-элементами III-группы

Стручева Н.Е., Новоженев В.А.

Алтайский государственный университет

Исследование сплавов редкоземельных металлов с Зр-металлами является очень актуальной задачей, вследствие их очень интересных физических и физико-химических характеристик. Диаграммы состояния бинарных систем тербия с Зр-металлами изучены достаточно хорошо [1-3].

Из тройных диаграмм состояния наиболее полно изучены на предмет фазового состава системы РЗМ-Mg-Al (РЗМ=Y, La, Ce, Pr, Nd, Gd, Tb, Dy) [4-10]. Во всех тройных системах с алюминием установлено образование тернарных соединений со структурным типом $MgZn_2$. Из тройных систем РЗМ-Mg-Ga в литературе имеются сведения только о системах с лантаном, церием, празеодимом и неодимом [11]. Для этих систем характерно образование тройных соединений $Mg_{15}Ga_{35}Ce_{50}$, $Mg_{15}Ga_{35}La_{50}$, $Mg_{15}Ga_{35}Pr_{50}$, $Mg_{15}Ga_{35}Nd_{50}$, однако структурный тип этих соединений не установлен. Данных о тройных системах РЗМ-Mg-In в литературе нет.

В настоящей работе проводилось рентгенографическое исследование сплавов тербий-магний с р-элементами III-группы в тройных системах. Из тройных диаграмм состояния в настоящее время есть сведения только о диаграмме Tb-Mg-Al [10].

Для исследования фазовых равновесий были синтезированы образцы сплавов с различным соотношением компонентов при 743 -1013 К в вакуумированных кварцевых ампулах. Для достижения равновесия образцы сплавов подвергали гомогенизирующему отжигу при 673 К в течение 200-350 часов с последующей закалкой в холодной воде. Вследствие испарения магния (потери составили 1-3 масс.%) проводили корректировку исходного состава и впоследствии образцы сплавов получали с учетом потерь.

Исследование образцов проводили методом рентгенофазового анализа проводили до и после отжига на установке ДРОН-2,0 с кобальтовым K_{α} -излучением.

В тройной системе Tb-Mg-Al при отжиге в течение 240 - 350 ч для сплавов, прилегающих к алюминиевому углу диаграммы состояния, по данным РФА, образуются два тройных соединения. Соединение $(Tb_{0,67}Mg_{0,33})Al_3$ (структурный тип $VaPb_3$,