

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ

**Учреждение образования
«Международный государственный экологический институт имени
А.Д. Сахарова»**

Белорусского государственного университета

ФАКУЛЬТЕТ ЭКОЛОГИЧЕСКОЙ МЕДИЦИНЫ

КАФЕДРА ЭКОЛОГИЧЕСКОЙ ХИМИИ И БИОХИМИИ

СИНТЕЗ СТЕРОИДОВ И ИХ ГЕТЕРОАНАЛОГОВ

Дипломная работа

Специальность 1-80 02 01 Медико-биологическое дело

Исполнитель:

студент 5 курса группы 32063

дневной формы обучения

подпись

Сушинская Ангелина

Александровна

Научный руководитель:

канд. биол. наук

подпись

Пырко Анатолий Николаевич

К защите допущена:

Заведующий кафедрой экологической химии и биохимии:

канд. хим. наук, доцент

подпись

Сыса А.Г.

МИНСК 2018

РЕФЕРАТ

Дипломная работа: Синтез стероидов и их гетероаналогов: 44 страницы, 11 рисунков, 4 таблицы, 40 источников.

СТЕРОИДЫ, ГЕТЕРОАНАЛОГИ, 11-АЗА-D-ГОМОАНАЛОГИ СТЕРОИДОВ, ОРГАНИЧЕСКИЙ СИНТЕЗ, ПЕСТИЦИДНАЯ АКТИВНОСТЬ

Цель работы: изучить литературные данные о природных соединениях стероидной структуры и их гетероаналогах, обобщение и систематизация материала. Осуществление органического синтеза гетероциклических аналогов, содержащих гетероатом азота в 11-ом положении стероидного скелета, изучение их пестицидной активности.

Методы исследований: химические; экологические.

Полученные результаты и их новизна. В ходе экспериментальной работы в две стадии осуществлен синтез 16,16-диметил-12-фенил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-он и 16,16-диметил-12-метил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-он конденсацией 1-нафтиламина с бензоил- и ацетилдимедоном соответственно и последующей циклизацией образовавшихся енаминодикетонов нагреванием в полифосфорной кислоте.

16,16-Диметил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-он получен трехкомпонентным взаимодействием димедона, 1-нафтиламина и ортомуравьиного эфира с последующей циклизацией образующегося енаминодикетона в полифосфорной кислоте.

Натрийборгидридным восстановлением 16,16-диметил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-она получен 16,16-диметил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-ол. Проведено тестирование трех из четырех полученных соединений на четыре вида фунгицидной, шести видов инсектицидной и шести видов гербицидной активности.

16,16-Диметил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-ол проявил активность против *heliothis virescens* и *diabrotica undecimpunctata howardi*. Соединение 16,16-диметил-12-фенил-11-аза-D-гомо-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегидрогонан-17а-он против, *diabrotica undecimpunctata howardi* (кукурузный жук).

Степень использования. Полученные соединения представляют интерес в качестве объекта испытаний биологической активности.

Область применения. Медицина, промышленность, образование.

РЭФЕРАТ

Дыпломная работа: Сінтэз стэроідаў і іх гетэрааналагаў: 44 старонак, 11 рысункаў, 4 табліцы, 40 крыніц.

СТЭРОІДЫ, ГЕТЭРААНАЛАГІ, 11-АЗА-D-ГОМААНАЛАГІ
СТЭРОІДАЎ, АРГАНІЧНЫ СІНТЭЗ, ПЕСТЫЦЫДНАЯ АКТЫЎНАСЦЬ

Мэта работы: вивучыць літаратурныя звесткі аб прыродных злучэннях стэроідных структур і іх гетэрааналагах, абагульненне і сістэматызацыя матэрыялу. Ажыццяўленне арганічнага сінтэзу гетэрацыклічных аналагаў, якія змяшчаюць гетэраатом азоту ў 11-ым становішчы стэроіднага шкілету, вивучэнне іх пестыцыднай актыўнасці.

Метады даследавання: хімічныя; экалагічныя.

Атрыманыя вынікі і іх навізна. У ходзе эксперыментальнай працы ў дзве стадыі быў ажыццёўлены сінтэз 16,16-дыметыл-12-феніл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ён і 16,16-дыметыл-12-меціл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ён кандэнсацыяй 1-нафтыламіна з бензаіл-ў ацетілдымедонам адпаведна і наступнай цыклізацыяй створаных енамінадыкетонаў награваннем ў паліфосфарнай кіслаце.

16,16-Дыметыл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ён атрыманы трохкампанентным узаемадзеяннем дымедона, 1-нафтыламіна і ортамурашынага эфіру з наступнай цыклізацыяй створанага енамінадыкетона ў паліфосфарнай кіслаце.

Натрыйборгідрыдным аднаўленнем 16,16-дыметыл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ёна атрыманы 16,16-дыметыл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ол. Праведзена тэставанне трох з чатырох атрыманых злучэнняў на чатыры віды фунгіцыдным, шасці відаў інсектыцыдным і шасці відаў гербіцыднай актыўнасці.

16,16-Дыметыл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ол праявіў актыўнасць супраць *heliolithis virescens* і *diabrotica undecimpunctata howardi*. Злучэнне 16,16-дыметыл-12-феніл-11-аза-D-гома-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-тетрадекадегідраганан-17а-ён супраць *diabrotica undecimpunctata howardi* (кукурузны жук).

Ступень выкарыстання. Атрыманыя злучэнні ўяўляюць цікавасць у якасці аб'екта выпрабаванняў біялагічнай актыўнасці.

Вобласць прымянення. Медыцына, прамысловасць, адукацыя.

ABSTRACT

Graduate work: Synthesis of steroids and their heteroanalogues: 44 pages, 11 figures, 4 tables, 40 sources.

STEROIDS, HETEROANALOGS, 11-AZA-D-HOMOANALOGY OF STEROIDS, ORGANIC SYNTHESIS, PESTICIDE ACTIVITY

Purpose of the research: to study the literature datas about the natural compounds of the steroid structure and their heteroanalogues, the generalization and systematization of the material. Implementation of organic synthesis of heterocyclic analogues containing nitrogen heteroatom in the 11th position of the steroid skeleton, study of their pesticidal activity.

Research methods: chemical; ecological.

The obtained results and their novelty. During the experimental work in two stages was done the synthesis of 16,16-dimethyl-12-phenyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrohonan-17a-one and 16,16-dimethyl-12-methyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrohonan-17a-one by condensation of 1-naphthylamine with benzoyl- and acetyldimedone respectively and subsequent cyclization of the resulting enaminediketones by heating in polyphosphoric acid.

16,16-Dimethyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrogonan-17a-one was obtained by the three-component interaction of dimedone, 1-naphthylamine and orthoformic ester, with following cyclization of the resulting enaminediketone in polyphosphoric acid.

After sodium borohydride recovery of 16,16-dimethyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrohonan-17a-one was obtained 16,16-dimethyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradeca-hydrogonan-17a-ol. Three of the four compounds on four fungicidal, six types of insecticidal and six types of herbicidal activity were tested.

16,16-Dimethyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrohonan-17a-ol was active against *heliobius virescens* and *diabrotica undecimpunctata howardi*. The compound 16,16-dimethyl-12-phenyl-11-aza-D-homo-1,2,3,4,5,6,7,8,9,10,11,12,13,14-tetradecahydrohonan-17a-one was active against *diabrotica undecimpunctata howardi* (corn beetle).

Degree of use. The received compounds are of interest as the object of biological activity tests.

Range of application. Medicine, industry, education.