

ХРОНИКА

ПЕРВАЯ МЕЖДУНАРОДНАЯ КОНФЕРЕНЦИЯ "ХИМИЯ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ АЗОТИСТЫХ ГЕТЕРОЦИКЛОВ И АЛКАЛОИДОВ"

С 9 по 12 октября 2001 г. в Москве состоялась 1-я Международная конференция "Химия и биологическая активность азотистых гетероциклов и алкалоидов". Эта конференция положила начало, как мы надеемся, циклу ежегодных международных конференций под общим названием "Химия и биологическая активность синтетических и природных соединений". Главный научный организатор и спонсор конференции – компания "InterBioScreen" при участии правительства г. Москвы и научно-методической поддержке Российской Академии наук. Спонсорами конференции выступили также Фонд "Научное партнерство", ОАО "Московский комитет по науке и технологиям" и коммерческие зарубежные компании "Matrix Technologies corporation", "Sigma Aldrich", "ChemNavigator" (США), Summit Pharmaceuticals International (Япония), а также российские и украинские фирмы "ДИАЭМ-современная лаборатория" (Москва), Группа предприятий ОСТ (Черноголовка), "Enamine" (Киев), "ExiMed" (Киев).

Целью организаторов конференции было предоставить возможность встретиться химикам-синтетикам, специалистам по химии природных соединений, медицинским химикам и фармакологам и, таким образом, убрать барьеры дисциплинарной специализации и дать возможность участникам, работающим в различных областях химии биологически активных соединений, обсудить наиболее актуальные вопросы современного состояния этой многогранной области науки.

Конференция собрала представительный форум ведущих ученых из России, Латвии, Украины, Беларуси, Казахстана, Узбекистана, Грузии, Армении, Таджикистана, Киргизии. Всего в конференции приняло участие около 300 человек из 77 городов и 140 ведущих институтов России и зарубежья.

На церемонии открытия конференции с приветствиями выступили академики Г. А. Толстиков, И. П. Белецкая, В. А. Тартаковский, Н. С. Зефирова, С. А. Андронати. И. П. Белецкая огласила приветствие делегатам от профессора А. Катрицкого (Флорида, США). Программа конференции была чрезвычайно насыщенной: 22 пленарных и 62 устных доклада, на стендовой сессии было представлено свыше 220 постеров.

В докладах нашли отражение различные направления современной химии гетероциклов, алкалоидов и медицинской химии, рассмотрены проблемы направленного синтеза и модификации новых синтетических и природных азотсодержащих биомолекул. Большое внимание было уделено вопросам строения и прогнозирования биологической активности как известных соединений, так и еще не созданных в лабораториях.

На секции "Направленный синтез и свойства биоактивных азотистых гетероциклов" наибольшее внимание участников конференции привлекли доклады Н. С. Зефириной и В. В. Поройкиной по изучению количественных соотношений структура – активность и компьютерному прогнозированию биологической активности органических молекул с целью фундаментального и надежного отбора

химических структур при создании лекарств. Доклады Г. Б. Елякова, С. М. Адекенова, Х. М. Шахидоятова, М. С. Юнусова (секция "Химия алкалоидов") были посвящены стратегии и тактике изучения природных алкалоидов как растительного, так и морского происхождения и выявления среди них соединений, полезных для медицинской практики. Интересные результаты, полученные в рамках научных программ InterBioScreen по химической модификации природных соединений, доложены В. Г. Карцевым. Основываясь на кольчато-цепной таутомерии котарнина, панкротина и других алкалоидов удалось осуществить их взаимодействие с разнообразными нуклеофильными и электрофильными реагентами. В результате были получены соединения, сочетающие структуру алкалоидов с барбитурильными, кумариновыми, индольными и другими фрагментами, а также уникальные синтоны для комбинаторной химии. В этом цикле исследований найден ряд новых интересных перегруппировок, в частности, перегруппировка 1-индолилкотарнина в 3-индолилкотарнин и осуществлен полный синтез некоторых труднодоступных природных соединений.

В докладе Р. Г. Костяновского и др. (Москва) "Новые пути к хиральным лекарствам" сообщалось о нетрадиционных, экономичных, оригинальных путях разделения рацематов без использования хиральных реагентов, которые открывают возможности получения оптически активных чистых монокристаллов простыми, доступными химикам методами. В докладе дано теоретическое толкование новым подходам в получении оптически активных чистых монокристаллов.

Новые результаты изучения гетероциклизации по реакции хинолов с енаминами (реакция Неницеску), представил В. Г. Граник (Москва). Варьируя структуры хинонов (прежде всего используя гетероциклические хиноны) и енаминов, докладчику удалось выяснить достаточно тонкие аспекты влияния строения реагирующих соединений на протекание альтернативных направлений реакции – формирования индольных и бензофурановых структур.

Обобщающий обзор исследований школы акад. А. А. Ахрема по синтезу производных хинолизина [2+4]-циклоконденсацией циклических шиффовых оснований, представил А. Л. Михальчук (Минск, Беларусь). Взаимодействием разнообразных циклических азометиннов (в частности производных дигидроизохинолина) с α,β -ненасыщенными кетонами, 1,3-диенами, 1,3-дикарбонильными соединениями и β -кетозфирами получены конденсированные многоядерные гетероциклические соединения, в частности гетероаналоги стероидов (например, 8-азастероиды), а также разработаны подходы к синтезу ряда изохинолиновых и индольных алкалоидов.

Результаты исследования связи строения гетероциклических лигандов серотониновых рецепторов на их сродство к рецепторам, изложил акад. С. А. Андронати (Одесса, Украина). Изучен большой ряд лигандов, включающих имидные фрагменты и пиперазиновый цикл, разделенные полиметиленовым мостиком, выяснено влияние модификации структуры лигандов на их сходство к белку-рецептору 5-НТ_{1A}R. Полученные данные позволяют прогнозировать биологическую активность лигандов и открывают подходы к направленному синтезу некоторых типов лекарственных препаратов.

Широкие возможности применения фосфорорганических реагентов в синтезе разнообразных, зачастую труднодоступных гетероциклических соединений были продемонстрированы в докладе Б. С. Драча (Киев). В докладе представлены основные достижения в этой области, преимущественно, докладчика и его сотрудников, за последние 25 лет. Убедительно показаны преимущества изученных реагентов в реакциях образования различных гетеросистем.

Превращениям модифицированных изофлавонов (3-гетарилхромонов) при их взаимодействии с гидразинами посвятил свой доклад В. П. Хиля (Киев). Показано, что во всех случаях происходит размыкание пиридинового цикла и последующая рециклизация образующихся промежуточных соединений в замещенные

пиразолы. Обнаружены гипогликемические, противовоспалительные и антивирусные свойства последних.

Потенциально биологически активные С-фосфорилированные азолы, бензазолы и более сложные фосфорсодержащие конденсированные гетеросистемы можно синтезировать, как было показано в докладе А. А. Толмачева (Киев, докладчик А. Н. Костюк), прямым С-фосфорилированием различных гетероциклических соединений.

К. Д. Пралиев (Алматы, Казахстан) сообщил об исследованиях, направленных на создание эффективных и селективных центральных анальгетиков, проводимые в Институте химических наук им. А. Б. Бектурова. Рассмотрены синтетические, стереохимические аспекты этих исследований в области химии пиперидинов и декагидрохинолинов, а также результаты фармакологического изучения полученных соединений. Важными практическими результатами работ, проведенных в институте совместно с российскими коллегами (фармацевтами и технологами) являются – создание нового анальгетика просидола и усовершенствование технологии получения известного центрального анальгетика промедола.

Учитывая важность научных материалов, представленных участниками конференции, и ее междисциплинарный характер, оргкомитет нашел возможным опубликовать научные материалы конференции в виде полноформатных обзоров (пленарные доклады), статей (устные доклады) и кратких сообщений (материалы стендовых сессий). Это привело к появлению двухтомника, который, как мы надеемся, станет началом периодического издания научных трудов будущих конференций.

В последний раздел 2-го тома включены описания 100 наиболее интересных методов синтеза и модификации гетероциклов, разработанных учеными СНГ и стран Балтии за последние несколько лет. Материалов в этот раздел пришло столь много, что InterBioScreen совместно с Фондом "Научное партнерство", приняли решение об издании отдельной периодической монографии "Избранные методы синтеза и модификации гетероциклов" в промежутках между конференциями.

Двухтомная монография материалов конференции издана также и на английском языке. Кроме того, вниманию участников конференции были предложены компактные диски, на которых можно было ознакомиться с электронным вариантом материалов монографии на русском и английском языках.

В рамках конференции состоялась встреча членов редколлегии журнала "Химия гетероциклических соединений" с авторами.

Конференция была организована высокопрофессионально и по мнению большинства участников соответствовала международному уровню.

На конференции состоялась церемония награждения Золотыми медалями "За вклад в науку и научное партнерство" с выделением именных стипендий, учрежденных Фондом "Научное партнерство" для одаренных аспирантов и студентов.

Награды присуждены:

Центру гетероциклических соединений Университета Флориды (директор – профессор **Алан Катрицкий**, США – *за заслуги перед мировой химической наукой и особый вклад в развитие международного сотрудничества*); Институту органической химии им. Н. Д. Зелинского РАН (директор – акад. РАН **В. А. Тартаковский**), Москва; Новосибирскому институту органической химии им. Н. Н. Ворожцова СО РАН (директор – акад. РАН **Г. А. Толстиков**); Институту физиологически активных веществ РАН (директор – акад. РАН **Н. С. Зефиров**), Черноголовка; Тихоокеанскому институту биоорганической химии Дальневосточного отделения РАН (директор – акад. РАН **Г. Б. Еляков**), Владивосток; Институту органического синтеза Уральского отделения РАН (директор – акад. РАН **О. Н. Чупахин**), Екатеринбург; Институту органической химии Уфимского Научного Центра РАН (директор – чл.-кор. РАН

М. С. Юнусов), Уфа; Физико-химическому институту им. А. В. Богатского НАН Украины (директор – акад. НАН Украины **С. А. Андронати**), Одесса; Институту химии растительных веществ им. С. Ю. Юнусова Республики Узбекистан (директор – профессор **Х. М. Шахидоятов**), Ташкент; Институту химических наук им. А. Б. Бектурова МОН Республики Казахстан (Алматы); Институту фитохимии Министерства образования и науки Республики Казахстан (директор – чл.-кор. АН Республики Казахстан **С. М. Адекенов**), Караганда; "Журналу органической химии" (главный редактор – акад. РАН **И. П. Белецкая**); журналу "Химия гетероциклических соединений" (главный редактор – акад. Латвийской АН **Э. Лукевиц**); ОАО "Московский комитет по науке и технологиям" Правительства Москвы (генеральный директор – профессор **В. Г. Систер**); Russian Section of the QSAR and Modeling Society (зам. председателя – профессор **В. В. Поройков**), Москва.

Серебряной медалью "За вклад в науку и научное партнерство" за цикл работ по химии миметиков природных соединений награжден коллектив ученых Института биорганической химии НАН Республики Беларусь, возглавляемый акад. **А. А. Ахремом**.

Кроме того, состоялось награждение авторов лучших пленарных и устных докладов, лучшей стендовой презентации памятной Золотой медалью "За вклад в науку и научное партнерство".

За лучшие пленарные доклады награждены:

В. Г. Граник, профессор (Москва); Б. С. Драч, профессор (Киев); Г. Б. Еляков, академик РАН (Владивосток); Б. А. Ивин, чл.-кор. РАЕН (Санкт-Петербург); Р. Г. Костяновский, профессор (Москва); В. П. Хиля, чл.-кор. НАН Украины (Киев).

За лучшие устные доклады награждены:

А. М. Демченко и авторский коллектив доклада (Чернигов); В. Н. Калинин (Москва); В. А. Каминский и авторский коллектив доклада (Владивосток); К. А. Краснов и авторский коллектив доклада (Санкт-Петербург); И. Ф. Макаревич и авторский коллектив доклада (Харьков); В. Ф. Миронов и авторский коллектив доклада (Казань); П. И. Пархоменко и авторский коллектив доклада (Киев); Л. А. Тюрина и авторский коллектив доклада (Уфа).

За лучшие стендовые доклады награждены:

В. С. Броварец и авторский коллектив доклада (Киев); М. М. Гаразд и авторский коллектив доклада (Киев); А. В. Силин и авторский коллектив доклада (Харьков); В. К. Хлесткин и авторский коллектив доклада (Новосибирск); И. Д. Шамьянов и авторский коллектив доклада (Ташкент).

Специальными дипломами и памятными Золотыми медалями за особый вклад в развитие современных методов синтеза и модификации гетероциклов награждены следующие авторские коллективы:

А. С. Норавян, Е. Г. Пароникян, А. П. Мкртчян, А. Ш. Оганисян, С. Н. Сиракян (Институт тонкой органической химии НАН Республики Армения); А. Г. Михайловский, Б. Я. Сыропятов, А. В. Долженко, В. С. Шкляев (Институт технической химии Уральского отделения РАН и Фармацевтическая Академия, г. Пермь); А. Н. Масливец, О. П. Красных, Н. А. Колюхова (Пермский государственный университет); Д. И. Сипкин, А. П. Молчанов, Ю. Б. Коптелов (Санкт-Петербургский университет); А. М. Газалиев, С. Д. Фазылов, О. А. Нуркенов, Р. З. Касенов, М. Ж. Журинов (Институт органического синтеза и углехимии МОН Республики Казахстан, Караганда).

2-я Международная конференция, посвященная кислород и серусодержащим синтетическим и природным гетероциклам, должна состояться в 2003 г.

В. Г. Карцев, Л. Ф. Семенова