

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

TOPICAL ISSUES OF NEW MEDICINES DEVELOPMENT

МАТЕРІАЛИ
XXVIII МІЖНАРОДНОЇ НАУКОВО-ПРАКТИЧНОЇ
КОНФЕРЕНЦІЇ МОЛОДИХ ВЧЕНИХ ТА СТУДЕНТІВ
ПРИСВЯЧЕНОЇ 150-РІЧЧЮ З ДНЯ НАРОДЖЕННЯ М.О. ВАЛЯШКА

18-19 березня 2021 року
м. Харків

Харків
НФаУ
2021

УДК 615.1

Редакційна колегія: проф. Котвіцька А. А., проф. Черних В. П.,
проф. Владимірова І. М.

Укладачі: Сурікова І. О., Литкін Д. В., Смєлова Н. М., Борко Є. А.,
Куриленко Ю. Є., Гордей К. Р.

Topical issues of new medicines development: матеріали XXVIII Міжнародної науково-практичної конференції молодих учених та студентів присвяченої 150-річчю з дня народження М.О. Валяшка (18-19 березня 2021 р., м. Харків). – Харків: НФаУ, 2021. – 682 с.

ISSN 2616-6615

Збірка містить матеріали науково-практичної конференції молодих учених та студентів «Topical issues of new medicines development», присвяченої 150-річчю з дня народження М. О. Валяшка, які згруповано за провідними напрямками науководослідної та навчальної роботи Національного фармацевтичного університету. Розглянуто теоретичні та практичні аспекти синтезу біологічно активних сполук і створення на їх основі лікарських субстанцій; стандартизації ліків, фармацевтичного та хіміко-технологічного аналізу; вивчення рослинної сировини та створення фітопрепаратів; сучасної технології ліків та екстемпоральної рецептури; біотехнології у фармації; досягнень сучасної фармацевтичної мікробіології та імунології; доклінічних досліджень нових лікарських засобів; фармацевтичної опіки рецептурних та безрецептурних лікарських препаратів; доказової медицини; сучасної фармакотерапії, соціально-економічних досліджень у фармації, маркетингового менеджменту та фармакоекономіки на етапах створення, реалізації та використання лікарських засобів; управління якістю у галузі створення, виробництва й обігу лікарських засобів; інформаційних технологій у фармації та медицині; основ педагогіки та психології; суспільствознавства; філології. Для широкого кола наукових і практичних працівників фармації та медицини.

УДК 615.1

ISSN 2616-6615

© НФаУ,
2021

Мета роботи. Метою роботи є огляд описаних у літературі способів трансформації камфори у карбонові кислоти з триметилциклопентановим та подібними до нього фрагментами.

Отримані результати. Камфорна кислота **1**, яку отримують з камфори окисненням нітратною кислотою, надалі може бути перетворена у ізомерні амінокислоти **3** і **4** шляхом розщеплення по Гофману відповідних амідів. Інший шлях модифікації кислоти **1** полягає у перетворенні на камфанову кислоту **5**, проміжним продуктом в цій реакції є 3-хлоркамфорний ангідрид. Перетворення метильної групи камфори у положенні **1** на карбоксильну з утворенням кетопінової кислоти **6** проводять через стадію 10-камфорсульфонової кислоти. Кислоту **6** і камфору можна окиснити до відповідних α -дикетонів **7** і **8** селен (IV) оксидом. Камфорхінон **8** окиснюється гідроген пероксидом до кислоти **1** у лужному середовищі, а у присутності церій амоній нітрату перегрупується у естер **9**. Сполука **8** здатна реагувати з розривом CO-CO зв'язку, наприклад циклізуючи о-амінофенол 3-(бензоксазол-2-іл)-1,2,2-триметилциклопентанкарбонову кислоту. Карбоксилуванням камфори отримують камфоркарбонову кислоту **10**. Кислота **10** розщеплюється у лужному середовищі до дикарбонової кислоти **11**. Окиснення камфори бензенселенатною кислотою призводить до суміші лактонів **12** і **13**. Засобами мікробіологічної трансформації можливе окиснення камфори у положеннях **5** і **6** з утворенням дикетону **14** і гідроксокетону **15**. Сполуки **14** і **15** мають потенціал до подальшої модифікації, наприклад у кетокислоту **16**.

Висновки. При використанні камфора, як вихідної сполуки, можна отримати близько десяти карбонових кислот з триметилциклопентановим фрагментом.

ПОШУК ФАРМАКОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН СЕРЕД 6-((5-(2,4- ТА 3,4-ДИМЕТОКСИФЕНІЛ)-3H-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛ)ТІО)ПІРИДИН-3- АМІНІВ ТА ЇХ ПОХІДНИХ

Довбня Д. В.

Науковий керівник: Каплаушенко А. Г.

Запорізький державний медичний університет, Запоріжжя, Україна

dima.dovbnya@ukr.net

Актуальність. Науковці всього світу працюють кожного дня заради забезпечення комфортного та якомога тривалішого життя людства, але не дивлячись на це кожна людина не може зберегти себе від будь-якого захворювання на 100 %. На сьогодні виявлено величезну кількість різноманітних захворювань, яка без припинення зростає.

Серед існуючих лікарських засобів є препарати в яких структурним фрагментом є ядро 1,2,4-тріазолу, які зарекомендували себе як високоефективні транквілізатори (тразодон, альпрозолам), протигрибкові (флуконазол, ітраконазол), противірусні (рибавірин), протипухлинні (летрозол) та інші засоби. Але недостатньо вивчено фармакологічну активність в ряді 2,4 та 3,4-дизаміщених 1,2,4-тріазол-3-тіону. Тому синтез, вивчення фізико-хімічних та біологічних властивостей 2,4 та 3,4-дизаміщених 1,2,4-тріазол-3-тіонів з нашої точки зору мають наукову новизну, теоретичну та практичну значимість .

Мета роботи. Метою нашої роботи є синтез 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксифеніл)-3H-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-амінів, дослідження реакції їх взаємодії з тіоціонатами, підтвердження будови синтезованих сполук фізико-хімічними методами аналізу.

Матеріали та методи. Проведено синтез нових 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-амінів та (6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-іл)кислот.

Як вихідні речовини для синтезу було використано 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-аміни, які отримані в результаті взаємодії 5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-тіонів з 5-аміно-2-хлорпіридином в лужно-спиртовому середовищі.

Шляхом взаємодії 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-амінів з відповідними тіоціонатами, як розчинник взято 1,4-діоксан, отримані (6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-іл)кислоти.

З метою підтвердження будови синтезованих сполук були використані фізико-хімічні методи (елементний аналіз, ІЧ-, ¹H, ЯМР-спектроскопії), хромато-мас-спектрометрії (LC/MS та GC/MS), рентгеноструктурний аналіз (потенціометрія).

Отримані результати. В результаті проведеної роботи були синтезовані 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-аміни, дослідження реакції їх взаємодії з тіоціонатами, підтвердження будови синтезованих сполук фізико-хімічними методами аналізу.

Висновки. Вперше були синтезовані 6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-аміни та (6-((5-(2,4- та 3,4-диметоксибеніл)-3*H*-1,2,4-тріазол-3-іл)тіо)піридин-3-іл)кислоти, дослідженні їх фізико-хімічні властивості, на сьогодні досліджується фармакологічна активність синтезованих сполук.

ІСТОРІЯ СТАНОВЛЕННЯ І РОЗВИТОК СПЕКТРАЛЬНИХ МЕТОДІВ ДОСЛІДЖЕННЯ БУДОВИ ОРГАНІЧНИХ СПОЛУК ПІД КЕРІВНИЦТВОМ ПРОФЕСОРА М.О. ВАЛЯШКА

Зубкова М.С., Власова А.О.

Науковий керівник: Шпичак Т.В.

Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна

shpuchaktamara@gmail.com

Актуальність. Спектральні методи дослідження і встановлення будови органічних сполук є невід'ємною складовою сучасних наукових досліджень. Історія виникнення і застосування методу сягає початку ХІХ століття з відкриттям інфрачервоної (ІЧ) у 1800 р. і ультрафіолетової (УФ) у 1802 р. частин спектра, що стало поштовхом для його використання у встановленні будови органічних сполук. Велике значення отримало виготовлення дифракційних решіток для дослідження лінійчатих спектрів і введення їх у практику німецьким фізиком Йозефом Фраунгофером (1815 р.). Започаткування спектральних методів в Російській Імперії, в Імператорському Харківському університеті, належить М.О. Валяшку, який став відомим науковому загалу саме цим дослідженням. Метод УФ-спектроскопії також дістав розвитку і удосконаленню у подальших наукових роботах у Харківському фармацевтичному інституті (зараз НФаУ) і Харківському хіміко-технологічному інституті (зараз НТУ «Харківський політехнічний інститут»), в яких працював М.О. Валяшко та його учні.

Мета роботи. Вивчення історичних фактів науково-дослідницької діяльності видатного вченого-органіка М.О. Валяшка щодо розвитку і використання спектроскопічних методів аналізу у встановленні будови органічних сполук, впливу замісників на спектральні характеристики і на біологічну активність.