

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ

**Державний вищий навчальний заклад
«Тернопільський державний медичний університет
імені І.Я. Горбачевського»**

**III Всеукраїнська науково-практична
конференція**

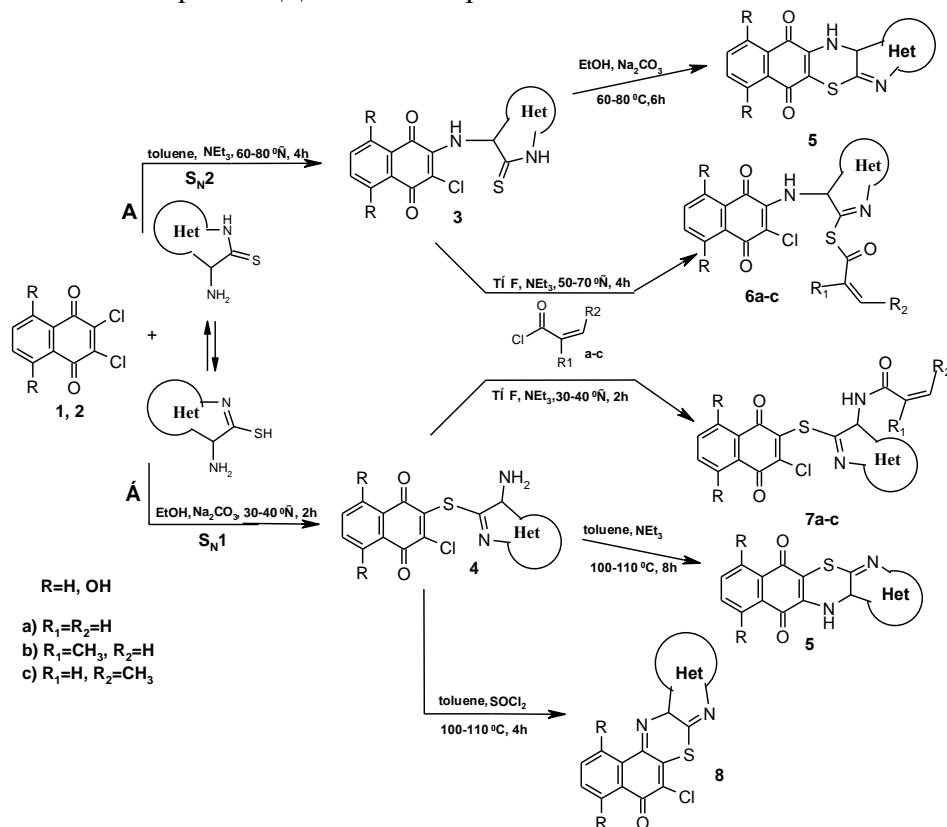
«ХІМІЯ ПРИРОДНИХ СПОЛУК»



30-31 жовтня 2012 року

Тернопіль
«Укрмедкнига»
2012

Встановлено, що заміщення атома хлору 2,3-дихлоро-1,4-нафтохінону **1** та 5,6-дигідрокси-2,3-дихлоро-1,4-нафтохінону **2** амбідентними S,N-бінуклеофілами контролюється реакційними умовами: в апротонних розчинниках утворюються виключно продукти N-ацилювання, у спиртових середовищах – продукти S-ацилювання, що у загальному підпорядковується правилу Корндблума. На основі сполук **3**, **4** синтезовані раніше не відомі похідні з системою подвійних зв'язків, які є перспективними реагентами для проведення на їх основі реакції Дільса-Альдера.



СИНТЕЗ ТА ПРОТИТУБЕРКУЛЬОЗНА АКТИВНІСТЬ ДЕЯКИХ ПОХІДНИХ 7,8-R-3-МЕТИЛ-1H-ПУРИН-2,6(3H,7H)-ДІОНУ

Васильєв Д. А., Прийменко А. О., Казунін М. С., Прийменко Б. О.,
Рохманова Н. А.*, Кулік М. Г.*

Запорізький державний медичний університет

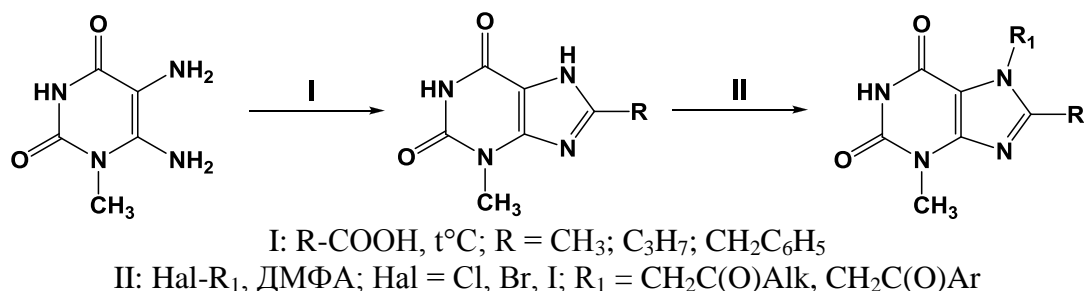
*Бактеріологічний відділ КДЛ КУ ЗОПТКД, м. Запоріжжя

Відомо, що похідні пуриндіона-2,6 входять до складу величезного числа біологічно активних сполук. Це пов'язано з тим, що молекула пурину має багато реакційних центрів, модифікація яких становить величезний інтерес для хіміків в плані отримання нових сполук.

Також відомо, що туберкульоз став найбільш розповсюдженим інфекційним захворюванням у світі. Останні часи спостерігається ріст захворюваності на фоні появи резистентних форм збудника туберкульозу з одночасним зниженням результативності лікування. Все це обумовлює постійне створення нових високоефективних лікарських препаратів.

Враховуючи наведені обставини, ми вирішили модифікувати молекулу вихідного пуриндіону-2,6.

В якості вихідної сполуки нами було використано доступний 5,6-діаміно-1-метилпіримідин-2,4(1*H*,3*H*)-діон. Незважаючи на те, що відомо безліч методів синтезу заміщених пуриндіона-2,6, запропонований нами метод є простим і ефективним. На багатьох етапах вихід отриманих сполук становив близько 80 %.



Дослідження протитуберкульозних властивостей отриманих сполук проведені *in vitro* в бактеріологічному відділі КДЛ КУ ЗОПТКД відносно штаму *Mycobacterium tuberculosis* H37Rv ATCC 27294. Сполуки, які мали гідразонну групу, показали досить високу антимікобактеріальну активність.

Гостра токсичність вивчалась за методом В. Б. Прозоровського. Первинний біологічний скринінг показав, що синтезовані сполуки є помірно та малотоксичними.

Будову всіх синтезованих сполук встановлено за допомогою ІЧ-, ПМР-спектроскопії та мас-спектрометрії.

Отримані дані свідчать про перспективність обраних нами класу сполук, як протитуберкульозних засобів.

СИНТЕЗ ТА ВЛАСТИВОСТІ ТІОСУЛЬФОНАТНИХ ПОХІДНИХ ХІНОКСАЛІНУ

Василюк С. В., Хоміцька Г. М., Монька Н. Я., Шиян Г. Б., Лубенець В. І., Новіков В. П.
 Національний університет „Львівська політехніка”

Серед гетероциклів, що зустрічаються як в природних речовинах, так і лікарських препаратах, вагому роль відіграють нітрогеновмісні гетероциклічні системи – потенційні донори *NO*. Хіноксалинони проявляють широкий спектр біологічної активності, зокрема, відомими є їх антидіабетичні, протипухлинні і противірусні ефекти, в тому числі і їх дія проти ретровірусів таких як ВІЛ. Відомо, що 1,4-дигідро-(1*H*,4*H*)-хіноксалин-2,3-діони є антагоністами рецепторів N-метил-D-аспартату, а також конкурентними антагоністами α-аміно-3-гідрокси-5-метил-4-ізоксазолпропіонатних рецепторів, вони належать до невеликої групи сполук, що проявляють ефект при різних патофізіологічних станах, таких як загальна і фокальна ішемія, епілесія, розсіяний склероз, хвороби Паркінсона і Альцгеймера.

Хіноксалинони є важливими структурами для створення нових лікарських субстанцій завдяки спорідненості до бенздіазепінів, проте, вони мало досліджені внаслідок обмежених способів їх синтезу. Обмеженими є також відомості про сульфуровмісні похідні хіноксалинонів. В зв'язку з цим нами проведені дослідження з синтезу тіосульфонатних похідних з хіноксалиновим фрагментом, оскільки відомо, що сполуки з тіосульфонатним фрагментом проявляють широкий спектр біологічної дії.