

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

СИНТЕЗ І АНАЛІЗ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН І ЛІКАРСЬКИХ СУБСТАНЦІЙ

Тези доповідей Всеукраїнської науково-практичної
конференції з міжнародною участю, присвяченої
80-річчю з дня народження доктора фармацевтичних наук,
професора О. М. Гайдукевича

12-13 квітня 2018 року
м. Харків

Харків
НФаУ
2018

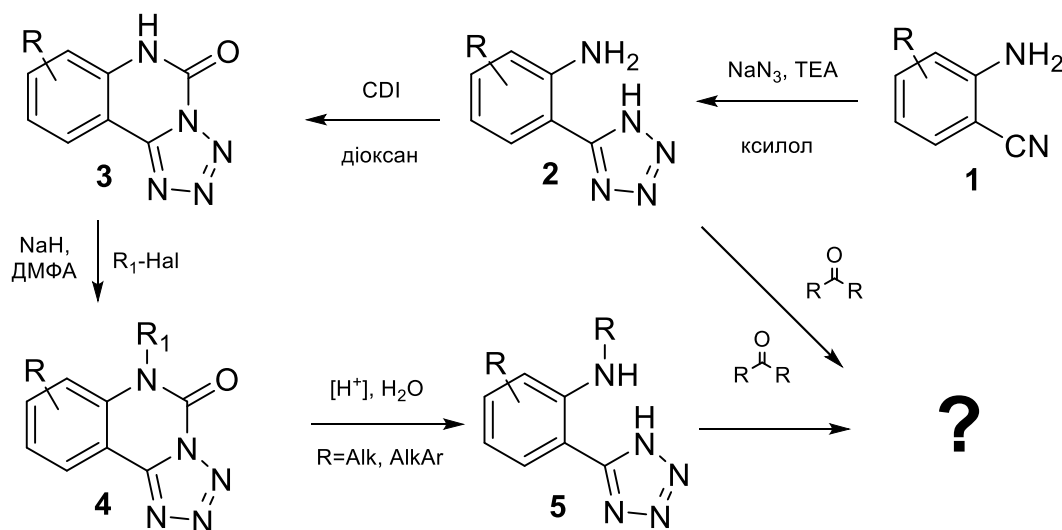
МЕТОДИ СИНТЕЗУ *N*-ЗАМІЩЕНИХ 2-(1*H*-ТЕТРАЗОЛО-5-ІЛ)АНІЛІНІВ

Антипенко О.М.

Запорізький державний медичний університет, Запоріжжя, Україна

antypenkoan@gmail.com

Тетразоло[1,5-*c*]хіназоліни – цікаві з фармакологічної точки зору гетероцикли, які за рахунок наявності у своїй структурі «фармакофорних» тетразольного та бензпіримідинового фрагментів, проявляють різносторонню біологічну активність (актопротекторна, антигіпоксична, протизапальна, протимікробна, протигрибкова, антирадикальна тощо). Методи їх синтезу відомі та зводяться до взаємодії 2-(1*H*-тетразоло-5-іл)анілінів (**2**) з різноманітними електрофільними реагентами. Зазначеними підходами нами синтезовано цілі ряди 5-заміщених тетразоло[1,5-*c*]хіназолінів, у тому числі тетразоло[1,5-*c*]хіназолін-5(6*H*)-он (**3**) та його *N*-похідні (**4**). Для розширення комбінаторної бібліотеки та синтетичних можливостей зазначеного гетероциклу з врахуванням методів їх формування, цікаво було одержати *N*-заміщені 2-(1*H*-тетразоло-5-іл)аніліни (**5**). Останні, як NCCCN-бінуклеофіли у реакціях [5+1]-циклоконденсації з карбонілвмісними сполуками можуть бути використані для формування маловідомих 5,6-дизаміщених 5,6-дигідротетразоло[1,5-*c*]хіназолінів.



Встановлено, що аніліни **5** утворюються як результат нуклеофільного розщеплення піримідинового циклу *N*-заміщених тетразоло[1,5-*c*]хіназолін-5(6*H*)-онів (**4**). Модифікація синтетичного протоколу показала, що більш кращим нуклеофільним реагентом є водний розчин хлористоводневої кислоти. У даному випадку реакція реалізується регіоселективно та з більш високими виходами.

Будова сполук **5** була підтверджена комплексом фізико-хімічних методів. Наприклад, ¹H ЯМР-спектри показали наявність характерних зсувів сигналів протонів NH-групи заміщеного аніліну та тетразольного циклу. Синтезовані сполуки планується дослідити на антирадикальну, протизапальну, протимікробну активності.

ЗМІСТ

КОСМЕТИКО-ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПАНИЯ «ГРИН ФАРМ КОСМЕТИК»	3
Сафонов В.А., Николов В.В.	
КОНСТРУЮВАННЯ, СИНТЕЗ І МОДИФІКАЦІЯ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ СПОЛУК, ДОСЛІДЖЕННЯ ЗВ'ЯЗКУ СТРУКТУРА-АКТИВНІСТЬ, МЕТОДИ ФАРМАКОЛОГІЧНОГО СКРИНІНГУ	
SYNTHESIS, ANTIBACTERIAL AND ANTIFUNGAL ACTIVITY OF DERIVATIVES OF 1,3,4-OXADIAZOLES	8
GRITSENKO I.S., ALFEROVA D.A., PARKHOMENKO V.YU., KAZAKOV G.P.	
IMMUNOMODULATORY EFFECT OF LACTOBACILLI AND BIFIDOBACTERIA.....	9
LOSIEVA D.	
SYNTHESIS AND PROPERTIES OF DERIVATIVE 2-AMINO-9H-3,4,9-TRIAZAFLUOREN.....	10
NOVODVORSKIY E.M., KHILYA O.V.	
RESEARCH OF BIOLOGICAL ACTIVITY OF S-PYRIDINE-DERIVATIVES CARBOXYLIC ACIDS	11
PETRUSHA YU.YU., OMELYANCHIK L.O., BRAZHKO O.A., ZAVGORODNIY M.P.	
SYNTHESIS, SPATIAL STRUCTURE AND ANALGESIC ACTIVITY OF ETHYL 4-HYDROXY-1-PHENYL-2,2-DIOXO-1H-2Λ⁶,1- BENZOTHIAZINE- 3-CARBOXYLATE	12
PETRUSHOVA L.A., UKRAINETZ I.V., ALEXEEVA T.V.	
PHARMACOLOGICAL STUDY OF AN OINTMENT WITH EXTRACT OF LICORICE ROOT ON THE EXPERIMENTAL MODEL OF NON-ALLERGIC CONTACT DERMATITIS	14
SHAKINA L.A., MALOSHTAN L.M.	
СКРИНІНГОВЕ ДОСЛІДЖЕННЯ АНТИОКСИДАНТНОЇ АКТИВНОСТІ ПОХІДНИХ КСАНТИНІЛ-7--АЦЕТАТНИХ КИСЛОТ	15
АЛЕКСАНДРОВА К.В., СІНЧЕНКО Д.М., МАКОЇД О.Б.	
МЕТОДИ СИНТЕЗУ N-ЗАМІЩЕНИХ 2-(1H-ТЕТРАЗОЛО-5-ІЛ)АНІЛІНІВ	16
АНТИПЕНКО О.М.	
ПОШУК БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ СПОЛУК СЕРЕД НОВИХ ВОДОРОЗЧИННИХ ПОХІДНИХ 4-R-5-(2-,3-4-ФТОРФЕНІЛ)-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОНІВ.....	17
БІГДАН О.А., ПАРЧЕНКО В.В.	