

Національна академія наук України  
Міністерство освіти і науки України  
Інститут органічної хімії НАН України  
Полтавський національний педагогічний  
університет ім. В.Г.Короленка

# Матеріали

XXIV УКРАЇНСЬКОЇ КОНФЕРЕНЦІЇ  
З ОРГАНІЧНОЇ ХІМІЇ



Полтава

19-23 вересня 2016 р.

УДК 547(043.2)

ББК 24.2

М 341

#### ОРГАНІЗАТОРИ

Національна академія наук України

Міністерство освіти і науки України

Інститут органічної хімії НАН України

Полтавський національний педагогічний університет ім. В.Г.Короленка

*У текстах тез доповідей, опублікованих у цьому збірнику, збережено оригінальний авторський стиль у поданні матеріалу та в написанні структурних формул хімічних сполук, схем реакцій і пояснень до них.*

*Original authors' style including interpretation, structural formulae of chemical compounds, schemes of the reactions, and explanations, is presented in the abstracts published in this collection.*

#### СПОНСОРИ

НВП «Єнамін», м.Київ	<a href="http://www.enamine.net">http://www.enamine.net</a>
НВП «Укроргсинтез», м.Київ	<a href="http://www.uoslab.com">http://www.uoslab.com</a>
ПАТ «Макрохім», м.Київ	<a href="http://www.macrochem.ua">http://www.macrochem.ua</a>
НВП «І.Ф.ЛАБ», м.Київ	<a href="http://www.iflab.kiev.ua">http://www.iflab.kiev.ua</a>
ПАТ «Фармак», м.Київ	<a href="http://www.farmak.ua">http://www.farmak.ua</a>

Матеріали XXIV Української конференції з органічної хімії. М 341 (Полтава, 19-23 вересня 2016 р.) – Полтава: Полтавський національний педагогічний університет ім. В.Г. Короленка, 2016. – 325 с.

До книжки ввійшли тексти виступів учасників XXIV Української конференції з органічної хімії

УДК 547(043.2)

ББК 24.2

©Полтавський національний педагогічний університет ім. В.Г. Короленка, 2016.

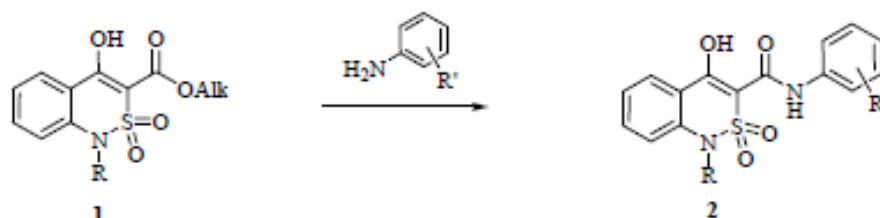
**СИНТЕЗ ТА АНАЛЬГЕТИЧНІ ВЛАСТИВОСТІ  
N-(ГІДРОКСИ[АЛКОКСИ]ФЕНІЛ)-4-ГІДРОКСИ-2,2-ДІОКСО-1H-  
2λ<sup>6</sup>,1-БЕНЗОТІАЗИН-3-КАРБОКСАМІДІВ**

*Петрушова Л.О., Українець І.В., Гріневич Л.О.*

*Національний фармацевтичний університет, вул. Пушкінська, 53, Харків  
igorukrainets710@gmail.com*

Створений ще в середині минулого століття ацетамінофен (парацетамол) зараз є одним з найбільш розповсюджених та застосовуваних ненаркотичних анальгетиків. Він входить до складу понад 200 різноманітних готових лікарських форм і активно застосовується як знеболюючий засіб в багатьох галузях медицини, включаючи педіатрію та ветеринарію. Зважаючи на це, в коло наших досліджень з пошуку нових анальгетиків серед 4-гідрокси-2,2-діоксо-1H-2λ<sup>6</sup>,1-бензотіазин-3-карбоксамідів було б доцільно залучити похідні з фрагментами *para*-амінофенолу (як діючої речовини ацетамінофену) та структурно близьких йому анілінів.

Для цього реакцією нижчих естерів 1-R-4-гідрокси-2,2-діоксо-1H-2λ<sup>6</sup>,1-бензотіазин-3-карбонових кислот (1) та амінофенолів чи їх *O*-алкілованих аналогів у киплячому ксилені були синтезовані відповідні гідрокси- та алкоксифенілзаміщені аніліди (2):



Alk = Me або Et;

R = H або Me;

R' = 2-OH, 3-OH, 4-OH, 2-OMe, 3-OMe, 4-OMe, 2-OMe-5-Cl, 4-OEt, 3,4-(OMe)<sub>2</sub>

Всі одержані нами були сполуки піддані фармакологічному скринінгу на виявлення анальгетичних властивостей на стандартній моделі "tail immersion test" паралельно та у порівнянні зі структурно близькими лікарськими препаратами мелоксикамом та піроксикамом. Серед вивчених речовин знайдені високоактивні анальгетики, які при пероральному введенні у дозі 20 мг/кг перевищують за знеболюючим ефектом референс-препарати у декілька разів і перспективні для поглиблених біологічних випробовувань.

**N-R-АМІДИ 1-ГІДРОКСИ-5-МЕТИЛ-3-ОКСО-9-ФЛУОР-  
6,7-ДИГІДРО-3H,5H-ПРИДО[3,2,1-ij]ХІНОЛІН-2-КАРБОНОВОЇ  
КИСЛОТИ – ПОТЕНЦІЙНІ ПРОТИТУБЕРКУЛЬОЗНІ ЗАСОБИ**

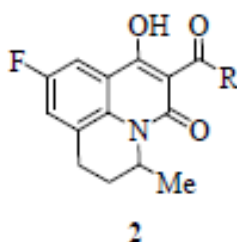
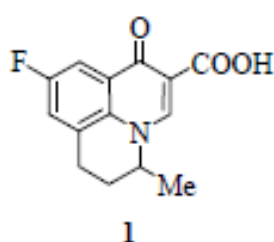
*Сидоренко Л.В., Українець І.В., Горохова О.В.*

*Національний фармацевтичний університет, вул. Пушкінська, 53, Харків*

*igorukrainets710@gmail.com*

За даними МОЗ України захворюваність на туберкульоз та смертність від цієї здавалося б уже давно переможеної хвороби в останні роки постійно зростають. Причиною такого становища є послаблення вироблених багаторічним досвідом профілактичних заходів, але в більшій мірі – значне поширення хіміо-, мультирезистентних та атипичних форм хвороби, які розповсюджуються дуже швидко і при цьому важко піддаються лікуванню традиційними протитуберкульозними препаратами. В арсеналі сучасних анти-бактеріальних хіміотерапевтичних засобів важливе місце займають препарати флуоро-хінолонового ряду, серед яких слід відзначити C<sub>(8)</sub>N<sub>(1)</sub> анельовані трициклічні похідні – офлоксацин, руфлораксацин або флумекін (1), що відрізняються високою активністю і хорошими фармакокінетичними властивостями.

Виходячи з цього, нами розроблено препаративний метод одержання та здійснено синтез великої серії структурно близьких аналогів флумекіну – 1-гідрокси-5-метил-3-оксо-9-флуор-6,7-дигідро-3H,5H-піридо[3,2,1-ij]хінолін-2-карбонову кислоти (2, R = OH), а також ряду її амідів і гідразидів (2, R = NH-X):



2: R = OH, діалкіламіноалкіламіно-, арилалкіламіно-, гетарилалкіламіно-

гетариламіно-, NHNH<sub>2</sub>, NHN=CH-Ry

Будова одержаних речовин

підтверджена даними елементного аналізу, спектрами ЯМР, мас-спектрами, а на окремих прикладах – рентгеноструктурним аналізом.

За результатами первинних мікробіологічних випробувань виявлені перспективні сполуки – гідрохлорид 1-етилпіролідін-2-іл-метил-, піридин-4-іл- та 3-метилпіридин-2-іл-аміди 2, які у концентрації 6,25 мкг/мл здатні на 95-100% блокувати розвиток *Mycobacterium tuberculosis* і представляють інтерес для подальших досліджень.



-П-

Павловский В.И.	Л-13, С-193, С-194	Петрушова Л.О.	С-218
Павловська Т.Л.	С-204	Пезько В.І.	С-217, С-74
Палій М.І.	С-132	Пивоваренко В.Г.	Д-53
Пальчиков В.О.	С-71	Писаненко Д.А.	С-144, С-164
Панасенко Н.В.	С-122	Підкович Х.Е.	Д-21
Пантьо В.В.	С-223	Піхун Н.В.	Д-6
Пацинкер Л.Д.	С-65	Пільо С.Г.	С-13, С-220, С-59
Перевода Л.О.	С-137	Піткович Х.Є.	С-165
Петко К.І.	Д-16, С-75	Плужник-Гладиш С.М.	С-77
Петрова О.М.	С-12	Покотило І.О.	С-34
Петрук О.М.	С-76	Покришко О.В.	С-24
Петрушка Б.М.	С-14		

318

XXIV Українська конференція з органічної хімії

Полевиченко С.І.	С-78	Походило Н.Т.	С-87
Поліщук П.Г.	Л-8	Приймєнко А.О.	Л-2
Половкович С.В.	С-44	Приймєнко Б.О.	С-125, С-126
Пономаренко Д.О.	С-166		С-125, С-126, С-138
Пономарьов М.Є.	Д-17, С-79	Приголько А.О.	С-227
Попов А.Ф.	С-100	Прокопенко В.М.	С-59
Попов Є.В.	С-42	Пузан А.М.	Д-11
Попова А.В.	Д-58, С-216, С-80	Пустовіт Ю.М.	Д-18
Посохов Є.О.	С-31	Присяжнік О.В.	Д-60

-Р-

Раль Н.І.	С-155	Роженко О.	Л-5
Раканко Г.Ф.	Л-7	Роженко О.Б.	Д-26, С-197, С-81, С-85
Рассуцкая Ю.В.	С-83	Розанцев Г.М.	С-97
Релькін Р.Г.	Д-55, С-175	Рокунець К.В.	С-133
Ремез О.С.	С-228	Романюк О.В.	Д-56
Решетула Т.В.	С-226	Рошенталер Г.В.	Л-3
Реміч Г.Г.	С-74	Руденко О.	С-35
Речинський О.Н.	С-219	Руденко О.П.	Д-51, С-173
Решетняк А.В.	С-71	Русаківна Н.В.	Л-1, С-203, С- 45, С-82
Рижченко В.П.	С-199	Русин І.Ф.	С-170
Ріпак Л.М.	С-136		
Родік Р.В.	Д-52, Д-54		
Романов В.М.	С-151, С-152, С-150		

-С-

Саберов В.Ш.	Л-7, С-167	Семенішин М.М.	С-82
Садченко А.О.	С-205	Семенова І.Г.	С-145
Сажко О.В.	Д-51	Семенова О.Н.	С-18
Сажников В.А.	Д-33	Семенюта І.В.	С-220
Сайгіт С.	С-200	Сергеева Т.Ю.	Д-2, С-70, С-130
Самарик В. Я.	С-162, С-172	Сидоренко Д.Ю.	Д-5
Самойленко В.О.	С-177	Сидоренко Л.В.	С-221
Самусенко Ю.В.	С-40, С-76	Сидорович М.М.	С-219
Сараєв В.Є.	С-37	Симчак Р.В.	С-14, С-23, С-24
Сатановський Я.М.	С-87	Сингаєвський В.О.	С-44
Сачко Я.І.	Д-24	Сизенко В.О.	С-39
Свалєвин Н.І.	С-73	Сиротенко Л.А.	С-206
Свалєвин О.В.	С-73	Ситнік К.М.	С-168
Свідло І.М.	С-206	Ситнік О.Ю.	С-168
Северинівська О.В.	С-74	Сігуров О.В.	С-13
Селіванова Є.А.	С-156		
Семененко О.М.	Л-12, С-205		

319