ЎЗБЕКИСТОН РЕСПУБЛИКАСИ
СОҒЛИҚНИ САҚЛАШ ВАЗИРЛИГИ
ТОШКЕНТ ФАРМАЦЕВТИКА ИНСТИТУТИ

“ФАРМАЦИЯ: ФАН, ТАЪЛИМ, ИННОВАЦИЯ ВА ИШЛАБ ЧИҚАРИШ” РЕСПУБЛИКА ИЛМИЙ-АМАЛИЙ АНЖУМАНИ (ХАЛҚАРО ИШТИРОКДА) МАТЕРИАЛЛАРИ

МАТЕРИАЛЫ РЕСПУБЛИКАНСКОЙ НАУЧНО ПРАКТИЧЕСКОЙ КОНФЕРЕНЦИИ «ФАРМАЦИЯ: НАУКА, ОБРАЗОВАНИЕ, ИННОВАЦИИ И ПРОИЗВОДСТВО» (С МЕЖДУНАРОДНЫМ УЧАСТИЕМ)

ТОШКЕНТ
2017

Тахрир хайъати
Раис: фармацевтика фанлари доктори, профессор Х. К. Джалилов

Аъзолар:
Р.Т.Туляганов – *биология фанлари доктори, доцент*
С.Н.Аминов – *кимё фанлари доктори, профессор*
Н.Т.Фарманова – *фармацевтика фанлари номзоди, доцент*

Тошкент фармацевтика институти Илмий кенгашининг 2017 йил 11-октябрдаги 3-сонли қарори билан чоп этишга тавсия этилган.

Введение гидрофобного фенильного радикала в линейную углеродную цепь молекулы метилового эфира приводит к наибольшему росту липофильности молекул в исследуемом ряду. Но при этом корреляционное уравнение зависимости log P – f(N) (N-общее количество атомов углерода в углеродном фрагменте молекулы) имеет лучшие статистические параметры по сравнению с уравнениями (1,2):

$$\log P = (1{,}45\pm0{,}12) + (0{,}26\pm0{,}03)N, \quad (3)$$
$$n=9,\ s=0{,}077,\ r=0{,}987$$

Попытки теоретического расчета коэффициентов распределение этих соединений методом Реккера [1] и с помощью компьютерной программы ACD/logP показали существенные отклонения экспериментальных данных от расчетных. Полученные данные позволяют рассчитать коэффициенты распределения в более широких изоструктурных рядах и провести молекулярный дизайн наиболее активных фармакофоров в этих рядах.

Выводы: Определены коэффициенты распределения 9 производных 2-(2-оксоиндолин-3-илиден)уксусной кислоты в системе октанол-1 - вода. Доказано, что липофильность исследуемых соединений зависит как от длины углеродной цепи, так и степени ее разветвленности. Получены статистически значимые корреляционные уравнения зависимости log P от количества углеродных атомов в радикале. Полученные уравнения позволяют рассчитывать log P в данном гомологическом ряду. Полученные данные используются в молекулярном дизайне активных фармакофоров в ряду производных 2-(2-оксоиндолин-3-илиден)уксусной кислоты.

Литература:

1.Rekker R. The Hydrophobic Fragmental Constant: its derivation and application with a means of characterizing membrane system.-Amsterdam.The Netherland: Elsevier, 1977. – 390 p.

Сытник К.М., Колесник С.В., Мороз В.П., Цапко Е.А.

ПРОСТОЙ СИНТЕЗ НОВЫХ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ СОЕДИНЕНИЙ ЛАКТОННОЙ ПРИРОДЫ НА ОСНОВЕ БЕНЗИЛОВОЙ КИСЛОТЫ.

Национальный фармацевтический университет, г. Харьков, Украина

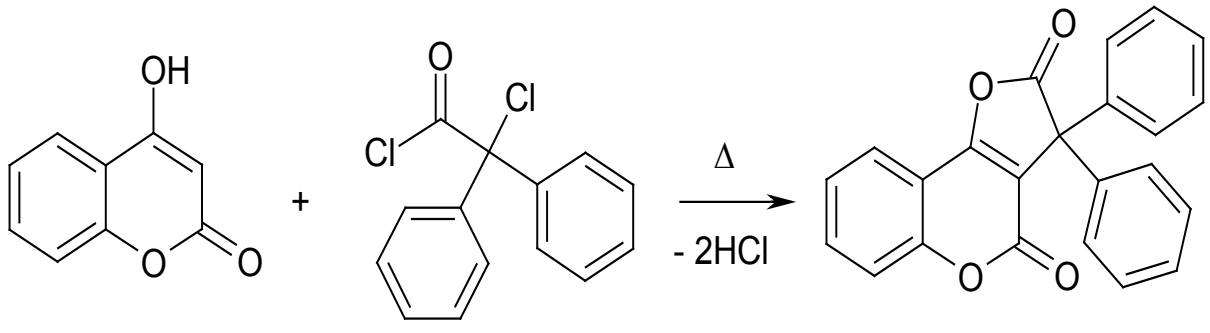
E-mail: sytnik.kostiantyn@gmail.com

Цель: Данная работа является продолжением приоритетного научного направления – синтез, определение физико-химических свойств и исследования биологической активности гетероциклических соединений на основе бензиловой кислоты. Ранее нами было показано, что при взаимодействии некоторых гетериламинов, а именно производных 3-аминотиофенов [1] и 6-аминоурацилов [2] с хлорангидридом дифенилхлоруксусной кислоты образуются новые гетероциклические соединения лактамной природы. Причем, в случае 6-аминоурацилов процесс гетероциклизации проходил без выделения промежуточного гетериламида бензиловой кислоты. Синтезированные гетероциклические системы были подвергнуты первичному биологическому скринингу. Среди них были найдены вещества с выраженной анксиолитической, психостимулирующей и антигипоксической активностями. Принимая во внимание перспективность синтезированных соединений как новых биологически активных субстанций, нами были продолжены исследования в этом направлении. В настоящей работе мы сообщаем о результате проведенных исследований взаимодействия 4-гидроксикумарина с хлорангидридом дифенилхлоруксусной кислоты. Выбор объектов не случаен: соединения объединяют в своей структуре несколько фармакофоров – производные кумарина и бензиловой кислоты. Поэтому целесообразным является синтез на основе гидроксигетероциклов и практическое изучение биологической активности полученных соединений, объединяющих указанные фармакофоры в одной структуре. Целью настоящей работы является расширение

класса исследуемых соединений, изучение их реакционной способности, химических свойств и биологической активности. Принимая во внимание высокий потенциал реакционной способности и биологической активности объектов исследования целесообразным является последующее практическое изучение их биологического действия.

Методы: В работе использованы стандартные приемы синтетической органической химии и результаты физико-химических методов, которые традиционно используются для доказательства структуры органических веществ (ПМР-спектроскопия, масс-спектрометрия).

Результаты: Мы обнаружили, что при проведении реакции в условиях кипячения компонентов в среде ледяной уксусной кислоты образуется 3,3-дифенил-3Н-фуро[3,2-с]хромен-2,4-дион **3**.



1 **2** **3**

В литературе имеются сообщения об альтернативном пути протекания реакции 4-гидроксикумарина 1 с хлорангидридами 2-хлоркарбоновых кислот, приводящим к образованию изомерных продуктов [3]. Однако, следует сообщить, что при этом были использованы экзотические катализаторы.

Направление исследуемой нами реакции хорошо согласуется с общепризнанными представлениями о реакционной способности енолов (4-гидроксикумарин). Структура соединения 3 надежно доказана с помощью инструментальных методов. В спектре ПМР наблюдаются сигналы протонов соответствующих мультиплетностей, которые соотносятся с сигналами протонов ABCD-системы кумаринового цикла и сигналы протонов двух фенильных радикалов. Молекулярный ион M^+ соответствует рассчитанному значению.

Выводы: Используя арсенал препаративных методов органического синтеза нам удалось применить реакцию гетероциклизации производных бензиловой кислоты к синтезу соответствующих лактонов на примере реакции 4-гидрокикумарина 1 с хлорангидридом 2. Полученный 3,3-дифенил-3Н-фуро[3,2-с]хромен-2,4-дион 3 представляет интерес для последующей химической модификации с целью поиска биологически активных веществ, поскольку содержит в своей структуре два электрофильных центра – карбонильные группы лактонных фрагментов.

Литература:

1. Сытник К.М., Шемчук Л.А., Кончаковская М.Е., Черных В.П. Использование ацидохромной циклоконденсации в синтезе 2-оксо-3,3-дифенил-2,3-дигидро-1Н-тиено-[3,4-b]-пиррол-6-карбоновой кислоты Журнал орг. та фарм. хімії. – 2007. – Т. 1, вип. 5 (17). С. 21-25.

2. Використання 1-R-6-аміноурацилів в одностадійному синтезі 1- R-5,5-дифеніл-5,7-дигідро-1Н-піроло[2,3-d]піримідин-2,4,6-тріонів Ситнік К.М., Григорів Г.В., Шемчук Л.А., Черних В.П., Цапко Є.О., Мороз В.П., Шпичак Т.В. Журнал орг. та фарм. хімії. – 2011. – Т. 9, вип. 2 (34).

3. F. Risitano, G. Grassi, F. Foti, C. Bilardo A convenient synthesis of furo[3,2-c]coumarins by a tandem alkylation / intramolecular aldolisation reaction nomagre Tetrahedron Letters 42 (2001) 3503-3505.

184.Хакимова Н.Ж., Абидова Ф.Н., Қаюмова Н.Н.
Эпюрани қайта тузиш ва проекция текисликларни алмаштириш усули мавзусига педагогик технологиянинг қўлланилиши.....287
185.Халдаров Х.А., Кадырова Г.А
Прикладная педагогике.....289
186.Хошимова Г.Ф., Хусанбаева Ю.Б.
Ижтимоий гуманитар фанларни ўқитишда замонавий таълим технологияларини қўллашнинг долзарблиги.....290
187.Шадманов К.К., Мирбабаев Ф.А.
Оценка эффективности инновационных проектов в фармацевтике.....291
188.Юлдашева С.М., Таряникова М.А
Юксак маънавиятли ёшларни тарбиялашда - таълим ва тарбиянинг ўзаро боғлиқлиги.....293
189.Юлдашева С. М.
Талабаларда мулоқат маданияти кўникмаларини шакллантиришнинг психологик усуллари.....294
190.Юсупова.Н.Э,
Олий таълим тизимида бадиий педагогиканинг ўрни.....296
191.Қиличев И.С.
Баркамол авлодни маънавий–ахлоқий ва бағрикенглик-ғояларида тарбиялаш муаммолари.....297

РАЗДЕЛ 5: РАЗРАБОТКА НОВЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ПРЕПАРАТОВ

192.Gladukh IE.V., Grubnik I.M., Yudina Yu.V.
Investigation of the rheological properties of gels with essential oil of lemongrass.....300
193.Ковалева Т.Н., Половко Н.П.
Разработка состава эмульсионного средства на основе масла амаранта.....301
194.Кухтенко Г.П., Гладух Е.В., Лазуренко Т.С.
Исследование реологического поведения гелевых дисперсных систем.....303
195.Сеги Анан Марсель, Николайчук Н.А., Гладух Е.В.
Обоснование выбора гелеобразователя для геля противовоспалительного действия.....305
196.Колесник С.В., Свечникова Е.Н.*, Винник А.Ф.*, Умаров У.
Липофильные свойства эфиров n-[(2-оксоиндо-линилиден-3)-2-оксиацетил]аминокислот.....306
197.Сытник К.М., Колесник С.В., Мороз В.П., Цапко Е.А.
Простой синтез новых гетероциклических соединений лактонной природы на основе бензиловой кислоты.....308
198.Н. В. Спиридонова, А. В. Силин*, В. А. Лебединец, О. А. Завада**
Разработка методики количественного определения субстанции 7-азепан-1-ил-1-этил-6-фтор-3-(4-фенил-1,3-тиазол-2-ил)-хинолина-4(1h)-она.....310
199.Ткаченко П.В.[1], Ткаченко Е.В.[1], Журавель И.А.[2]
Реакция замещенных 5-аминопиразолов з α-галогенокетонами.....311
200.Трищук Н.М., Киреев И.В., Колесник С.В., Сытник К.М.
Исследование влияния производных бензиловой кислоты на порог болевой чувствительности с помощью теста «горячей пластины».....313
201.Saidmukhamedova D.Yu., Khadjimetova K.R., Karieva E.S.
Biopharmaceutical studies in vitro of gel of dexpanthenol.....314
202.Азимова Н.А. [1], Холмуминов А.А. [2]
Изучение реологических свойств липосомальной мази ибупрофена на полимерной основе.....316

“ФАРМАЦИЯ: ФАН, ТАЪЛИМ, ИННОВАЦИЯ, ИШЛАБ ЧИҚАРИШ” РЕСПУБЛИКА ИЛМИЙ-АМАЛИЙ АНЖУМАНИ (ХАЛҚАРО ИШТИРОКДА) МАТЕРИАЛЛАРИ

МАТЕРИАЛЫ РЕСПУБЛИКАНСКОЙ НАУЧНО ПРАКТИЧЕСКОЙ КОНФЕРЕНЦИИ (С МЕЖДУНАРОДНЫМ УЧАСТИЕМ) «ФАРМАЦИЯ: НАУКА, ОБРАЗОВАНИЕ, ИННОВАЦИИ И ПРОИЗВОДСТВО»

Муҳаррир Худойберди Пўлатхўжаев
Рассом Яшар Рахимов
Саҳифаловчи Зохидхўжа Пўлатхўжаев
Мусаҳҳиҳ Эгамберди Жабборов

Босишга 01.11.2017-йилда рухсат этилди.
Қоғоз бичими 60×84 1/8. Нашр табоғи 64,0.
Шартли босма табоқ 64.5 Шартнома 18/21. Адади 100
Буюртма № 29–37

«O‘ZBEGIM DASTURLARI» МЧЖ босмахонасида чоп этилди.
100077 Тошкент, Мустақиллик шоҳкўчаси, 38.
E-mail: uzdas@mail.ru
Телефон: (0 371) 267-50-11