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

УДК 615.1:54.057:577.15/.17(043.2)
С 38

Редакційна колегія:

проф. А. А. Котвіцька, акад. НАН України, проф. В. П. Черних, доц. А. І. Федосов, проф. А. Л. Загайко, проф. І. С. Гриценко, проф. В. А. Георгіянц, проф. Л. А. Шемчук, проф. Л. О. Перехода, проф. О. М. Свєчнікова, проф. С. В. Колісник

С 18 **Синтез** і аналіз біологічно активних речовин і лікарських субстанцій : тези доповідей Всеукр. наук.-практ. конф. з міжнар. участю, присвяченої 80-річчю з дня народження доктора фармацевтичних наук, професора О. М. Гайдукевича (12-13 квітня 2018 р.). – Х. : НФаУ, 2018. – 404 с.

Збірка містить матеріали Всеукраїнської науково-практичної конференції з міжнародною участю «Синтез і аналіз біологічно активних речовин і лікарських субстанцій» (12-13 квітня 2018 р.). Матеріали згруповано за науковими напрямками: конструювання, синтез і модифікація біологічно активних сполук, дослідження зв'язку структура – активність, методи фармакологічного скринінгу; сучасні підходи до створення нових лікарських та косметичних засобів, функціональних харчових та дієтичних добавок; аналітичні аспекти у синтезі біологічно активних сполук та створенні нових лікарських засобів; контроль якості лікарської рослинної сировини, фітопрепаратів, парфумерно-косметичних засобів та функціональних харчових добавок; сучасний фармацевтичний аналіз та стандартизація ліків; хіміко-токсикологічний аналіз біологічно активних речовин та лікарських засобів.

Для широкого кола науковців та практичних працівників фармації і медицини.

Матеріали подаються мовою оригіналу. За достовірність опублікованих результатів повну відповідальність несуть автори.

УДК 615.1:54.057:577.15/.17(043.2)

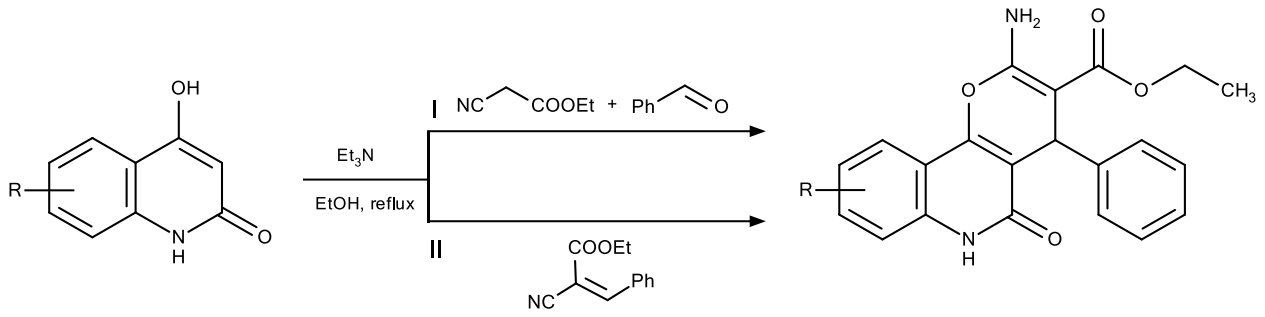
© НФаУ, 2018

ПОРІВНЯННЯ ОДНОСТАДІЙНОГО І ПОСЛІДОВНОГО МЕТОДІВ СИНТЕЗУ ПІРАНО[3,2-С]ХІНОЛІНІВ

Зубков В.О., Сич І.А., Єрьоміна З.Г., Кізь О.В.
Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна
vadim.zubkov@nuph.edu.ua

Шестичленні оксигенвмісні гетероциклічні сполуки такі як 4Н-пірани є важливим класом природних і синтетичних БАР, які відіграють фундаментальну роль в біоорганічній хімії. Також добре відомо, що гетероциклічні системи, які містять хінолінове ядро, є привілейованими скафолдами в медичній хімії, на основі яких створено велику кількість добре відомих лікарських препаратів. Невичерпний інтерес дослідників проявляється до конденсованих піранохінолонових структур, так як цей базовий каркас входить до складу природних алкалоїдів фліндерзину, оріцину і верпрізину. Крім того відомо, що піранохінолони володіють широким спектром біологічної активності - протипухлинною, антиалергічною, психотропною, протизапальною та антибактеріальною діями.

На сьогоднішній момент одним з найпоширеніших методів синтезу піранохінолінів є одностадійна трикомпонентна конденсація між метиленактивними нітрилами, альдегідами та відповідними гетероциклами в умовах лужного каталізу [1].



Для одержання етилових естерів 2-аміно-5-оксо-4-феніл-4Н,5Н,6Н-пірано[3,2-с]хінолін-3-карбонових кислот нами було апробовано два синтетичних протоколи. Перший з них полягав у проведенні "one-pot"синтезу між 4-гідрокси-2-оксохінолінами, ціаноцтовим естером та бензальдегідом (метод I). У другому випадку попередньо був синтезований бензиліденціаноцтовий естер, який потім був введений у реакцію з 4-гідрокси-1,2-дигідрохінолін-2-онами (метод II). В результаті порівняльного аналізу цих методів синтезу за такими параметрами як вихід та ступінь чистоти кінцевих продуктів було встановлено, що більш доцільним є послідовний спосіб синтезу пірано[3,2-с]хінолонів (метод II), а не одностадійний. Виходи цільових сполук відрізнялися більш, ніж в 2 рази.

---

1. Shestopalov, A. A., et al. "Single-step synthesis of substituted 7-aminopyrano [2, 3-d] pyrimidines." Russian chemical bulletin 53.10 (2004): 2342-2344., doi: 10.1007/s11172-005-0128-4