

Современные проблемы развития
фундаментальных и прикладных наук

*The main directions in
the development of
basic and applied
sciences*

Vol. 1

spe Science of European

*Материалы III международной
научно-практической конференции*

**«Современные проблемы развития
фундаментальных и прикладных наук»**

25 апреля 2016 г.

Praha, Czech Republic

Том 1

Содержание

Медицина и здравоохранение

Аверьянов С.В., Гараева К.Л., Исхаков И.Р., Исаева А.И. Изучение распространенности и интенсивности кариеса зубов, заболеваний пародонта и анкетирование детей города Уфы.....	4
Айро И.Н., Бондарева Т.М., Цидаева М.К., Ревазов А.Т. Клинико-эпидемиологическая характеристика сахарного диабета в Республике Северная Осетия-Алания.....	8
Антонова А.А., Сердюков В.Г. Отдых и оздоровление детей и подростков в летних оздоровительных учреждениях Астраханской области.....	11
Boyko N.V., Kolmakova T.S., Blood hormones level in patients with meniere's disease.....	16
Boyko N.V., Kolesnikov V.N. Surgical management of labyrinthine fistula in chronic otitis media.....	19
Волынкина А.П., Горшков И.П. Особенности системы гемостаза у больных сахарным диабетом 2 типа.....	23
Буриков М.А., Шульгин О.В. Сравнительный анализ результатов предложенного метода формирования ненатяжной манжеты у больных с грыжами пищеводного отверстия диафрагмы.....	25
Вишневецкая И.Ф., Курятникова Г.К., Ахмерова Р.Р., Мартова О.В. Влияние терапии на метаболическую активность нейтрофилов при лихорадке Ку.....	29
Газизова А.Ф., Курбатов Е.Р., Бобылева А.А. Синтез, свойства и противомикробная активность R-бензилиденгидразидов NH-бензоил-5-йод-антраниловой кислоты..	31
Горбатиук Н.О., Черников М.В., Терехов А.Ю., Маширова С.Ю., Приходько М.А. Изучение влияния суммы тритерпеновых кислот облепихи и клюквы на показатели гемостаза животных на фоне витаминной модели гиперлипидемии.....	35
Горюнова А.В., Скрипка М.О. Гигиена полости рта у беременных женщин.....	38
Григоренко В.В., Еськов В.М., Синенко Д.В. Исследование процессов хаотической динамики параметров сердечно-сосудистой системы.....	40
Данилова Е.И., Челпаченко О.Е., Федотова Е.И., Перунова Н.Б., Иванова Е.В., Никифоров И.А. Клиническая характеристика и особенности кишечного микробиоценоза у детей с реактивным артритом.....	44

- лихорадке / С.Ф. Карпенко, Х.М. Галимзянов, Н.Б. Касимова и др. // Астраханский медицинский журнал. – 2010. – Т. 5, № 4. – С. 38–41.
3. Карпенко, С.Ф. Клиника и некоторые показатели неспецифической резистентности при лихорадке Ку / С.Ф. Карпенко, Х.М. Галимзянов, Н.Б. Касимова и др. // Эпидемиология и инфекционные болезни. – 2010. – № 6. – С. 38–42.
 4. Карпенко, С.Ф. Содержание розеткообразующих нейтрофилов и лизоцима у больных лихорадкой Ку / С.Ф. Карпенко, Х.М. Галимзянов, Н.Б. Касимова, О.В. Рубальский // Клиническая лабораторная диагностика. – 2012. – № 8. – С. 55–56.
 5. Карпенко, С.Ф. Современное представление о клинике и терапии коксиеллеза / С.Ф. Карпенко // Вестник новых медицинских технологий. – 2013. – Т. 20, № 3. – С. 117–122.
 6. Карпенко, С.Ф. Оптимизация терапии коксиеллеза сочетанием стандартного лечения с индуктором интерферонов / С.Ф. Карпенко, Х.М. Галимзянов, О.Н. Горева, А.В. Красков // Журнал инфектологии. – 2015. – прил. Т. № 3. – С. 43–44.
 7. Карпенко, С.Ф. Клинико-патогенетические особенности развития острого гепатита при коксиеллезе / С.Ф. Карпенко, Х.М. Галимзянов, Р.С. Аракельян // Медицинская иммунология. – 2015. – Т.17, №3s. – С. 111–112.
 8. Нарциссов, Р.П. Энзимы в профпатологии / Р.П. Нарциссов. – М., 1981. – С. 32.

ГАЗИЗОВА А.Ф.¹, КУРБАТОВ Е.Р.², БОБЫЛЕВА А.А.³

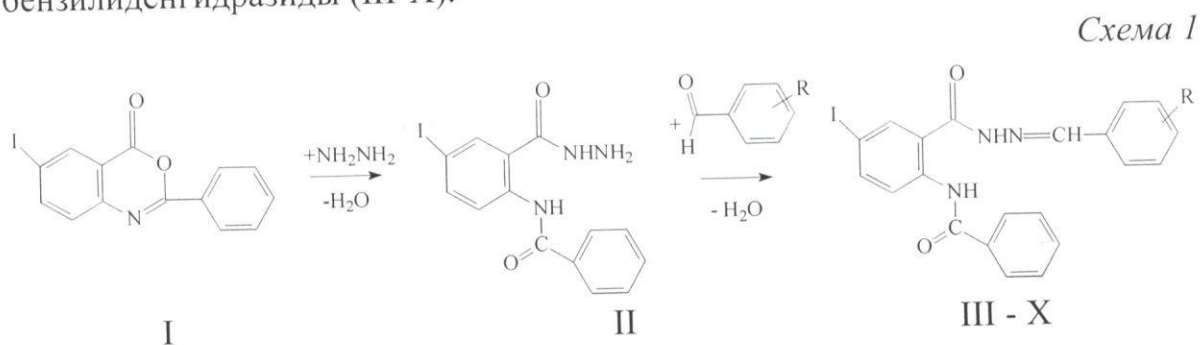
¹ – аспирант кафедры фармацевтической химии ФОО ПГФА; ² – д.ф.н., доцент кафедры фармацевтической химии ФОО ПГФА; ³ – к.ф.н., старший преподаватель кафедры микробиологии с основами гигиены ПГФА.

СИНТЕЗ, СВОЙСТВА И ПРОТИВОМИКРОБНАЯ АКТИВНОСТЬ R-БЕНЗИЛИДЕНГИДРАЗИДОВ NH-БЕНЗОИЛ-5-ЙОД-АНТРАНИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

Производные антраниловой кислоты являются перспективным классом веществ для поиска новых биологически активных соединений с различными видами фармакологического действия (противовоспалительное, анальгетическое, гипогликемическое, противомикробное и др.) при низкой токсичности [1, 2].

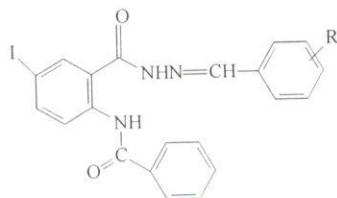
Целью работы является синтез новых биологически активных соединений в ряду R-бензилиденгидразидов NH-бензоил-5-йодантраниловой кислоты.

2-Бензоил-6-йод-3,1-бензоксазин-4-он (I) получен внутри-молекулярной циклизацией N-бензоил-5-йодантраниловой кислоты в среде пропионового ангидрида. При взаимодействии соединения I с гидразингидратом в среде этанола в течение 1 ч при 18-20 °С синтезирован гидразид N-бензоил-5-йодантраниловой кислоты (II), по известной методике [3], конденсацией которого с ароматическими альдегидами получены соответствующие R-бензилиденгидразиды (III-X).



R= H (III), R= 4- N(C₂H₅)₂ (IV), R= 2,4 – OCH₃ (V), R= 4-NO₂ (VI), R= 4-Br (VII), R= 4- N(CH₃)₂ (VIII), R= 4- J (IX), R= 2-NO₂ (X).

Синтезированные соединения являются кристаллическими или аморфными веществами белого с желтоватым, зеленоватым или желтого цвета, нерастворимыми в воде, этаноле, растворимыми в органических растворителях (ДМСО, ДМФА), строение которых подтверждено данными ЯМР ¹H – спектроскопии.



Физико-химические и спектральные характеристики R-бензилиденгидразидов NH-бензоил-5-йодантраниловой кислоты

№ п/п	R	T _{пл} , °C	Выход, %	ЯМР ¹ H (ДМСО-d ₆), δ, м.д.:
III	H	118-120	51,2	7,41 – 8,37 м (14H, 3Ar + CH); 11,75 с (H, CONH); 12,02 с (H, NHCO).
IV	4-N(C ₂ H ₅) ₂	132-134	51,7	1,06 – 1,17 т (6H, 2CH ₃); 3,27 – 3,47 м (4H, 2CH ₂); 6,59 – 8,30 м (13H, 3Ar + CH); 11,69 с (H, CONH); 11,95 с (H, NHCO).
V	2,4-OCH ₃	201-202	64,9	3,80 с (6H, 2OCH ₃); 6,57– 8,62 м (12H, 3Ar + CH); 11,84 с (H, CONH); 11,91 с (H, NHCO).
VI	4-NO ₂	242-244	82,5	7,53 – 8,43 м (12H, 3Ar + CH); 11,58 с (H, CONH); 12,24 с (H, NHCO).
VII	4-Br	248-250	67,2	7,55 – 8,33 м (13H, 3Ar + CH); 11,70 с (H, CONH); 12,06 с (H, NHCO).
VIII	4-N(CH ₃) ₂	208-210	65,7	3,28 с (6H, 2CH ₃); 6,64 – 8,37 м (13H, 3Ar + CH); 11,77 с (H, CONH); 11,92 с (H, NHCO).
IX	4-J	250-251	70,4	7,41 – 8,31 м (13H, 3Ar + CH); 11,71 с (H, CONH); 12,01 с (H, NHCO).
X	2-NO ₂	255-256	61,7	7,52 – 8,77 м (13H, 3Ar + CH); 11,66 с (H, CONH); 12,28 с (H, NHCO).

Экспериментальная химическая часть

Спектры ЯМР¹H синтезированных соединений записаны на Фурье-спектрометре фирмы Tesla BS-567A (рабочая частота 100 МГц) в ДМСО-d₆ (дейтерированном диметилсульфоксиде), внутренний стандарт – ГМДС. Расчёт химических сдвигов протонов вели по шкале δ, м.д. Ход реакций и чистоту полученных продуктов контролировали методом ТСХ на пластинках Sorbfil ПТСХ-П-В в системе растворителей бензол-хлороформ-ацетон, 9:1:1, пятна детектировали парами йода.

Бензилиденгидразид NH-бензоил-5-йодантраниловой кислоты (III)

К взвеси 0,001 моль гидразида NH-бензоил-5-йодантраниловой кислоты (II) в 5 мл этанола добавляют 0,0012 моль бензальдегида и перемешивают в течение 1 ч при температуре 18-20°C. Полученный осадок отфильтровывают, сушат и перекристаллизовывают из ацетонитрила. Выход 51,2%. T_{пл}=118 – 120°C.

Соединения IV – XI получены аналогично.

Экспериментальная биологическая часть

Бактериостатическую активность по отношению к штаммам *S. aureus* ATCC 6538-P и *E. coli* ATCC 25922 определяли методом двукратных серийных разведений в жидкой питательной среде [4]. В качестве растворителя соединений использовали диметилформамид. Для исследуемых соединений определяли минимальные подавляющие концентрации.

Установлено, что вещества оказывают противомикробное действие в концентрации 1000 мкг/мл по отношению к обоим штаммам.

Таким образом, поиск новых биологически активных соединений среди бензилиденгидразидов NH-бензоил-5-йодантраниловой кислоты является перспективным.

Список литературы:

1. Синтез, свойства и биологическая активность амидов N-ацил(алкенил)-5-йод(Н)антраниловых кислот / Е.Р. Курбатов, Л.М. Коркодинова, А.Г. Гольдштейн и др. // Хим. - фармац. журн. – 2014. – Т. 48, № 12. – С. 20–24.
2. Гипогликемическая активность замещенных амидов галогенантраниловых кислот / Е.Р. Курбатов, Т.А. Чупина, Л.М. Коркодинова и др. // Хим. - фармац. журн. – 2014. – Т. 48, № 10. – С. 37–38
3. Власова Н.А., Синтез и свойства ацилгидразидов N-бензоил-5-йодантраниловой кислоты / Н.А. Власова, Е.Р. Курбатов, Л.М. Коркодинова // Достижения и перспективы в области создания новых лекарственных средств: Материалы Российской научно-практической конференции, посвященной 70-летию ПГФА (27-28 ноября 2007г.).- Пермь, 2007.-С. 19-22 .
4. Руководство по экспериментальному (доклиническому) изучению новых фармакологически активных веществ / под общ. ред. Р.У. Хабриева. – 2-е изд., перераб. и доп. – М.: Медицина, 2005. – 832 с.