

білімді беру арқылы оқушылардың қажеттіліктерін ескере отырып сабақ ұйымдастыру болып табылады.

СИНТЕЗ И ИССЛЕДОВАНИЕ БИСТИАЗОЛОВ В КАЧЕСТВЕ СУБСТАНЦИЙ НОВЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

Салькеева Л.К., Минаева Е.В., Жортарова А.А., Усенова М.С.,
Нурмаганбетова М.Т., Омашева А.В.

НАО Карагандинский университет им. Е.А. Букетова, г. Караганда,
Казахстан

В настоящее время в условиях глобализации произошел резкий рост заболеваемости населения планеты практически по всем областям: от сердечно-сосудистых и онкологических до психических расстройств и эпидемий, что привело к стимулированию исследований в области создания новых лекарственных субстанций.

Известно, что основная масса лекарственных препаратов является гетероциклическими соединениями. Среди биологически активных веществ, особо перспективными являются производные серо- и азотсодержащих гетероциклов, в частности тиадиазолы. Очевидно, это связано с широким потенциалом биологической активности производных тиазолов, которые входят в состав большого количества природных лекарственных веществ и витаминов. Эти факторы продолжают стимулировать ученых к продолжению исследований в данной области как с целью получения новых лекарственных веществ, а также совершенствованию уже имеющихся технологий.

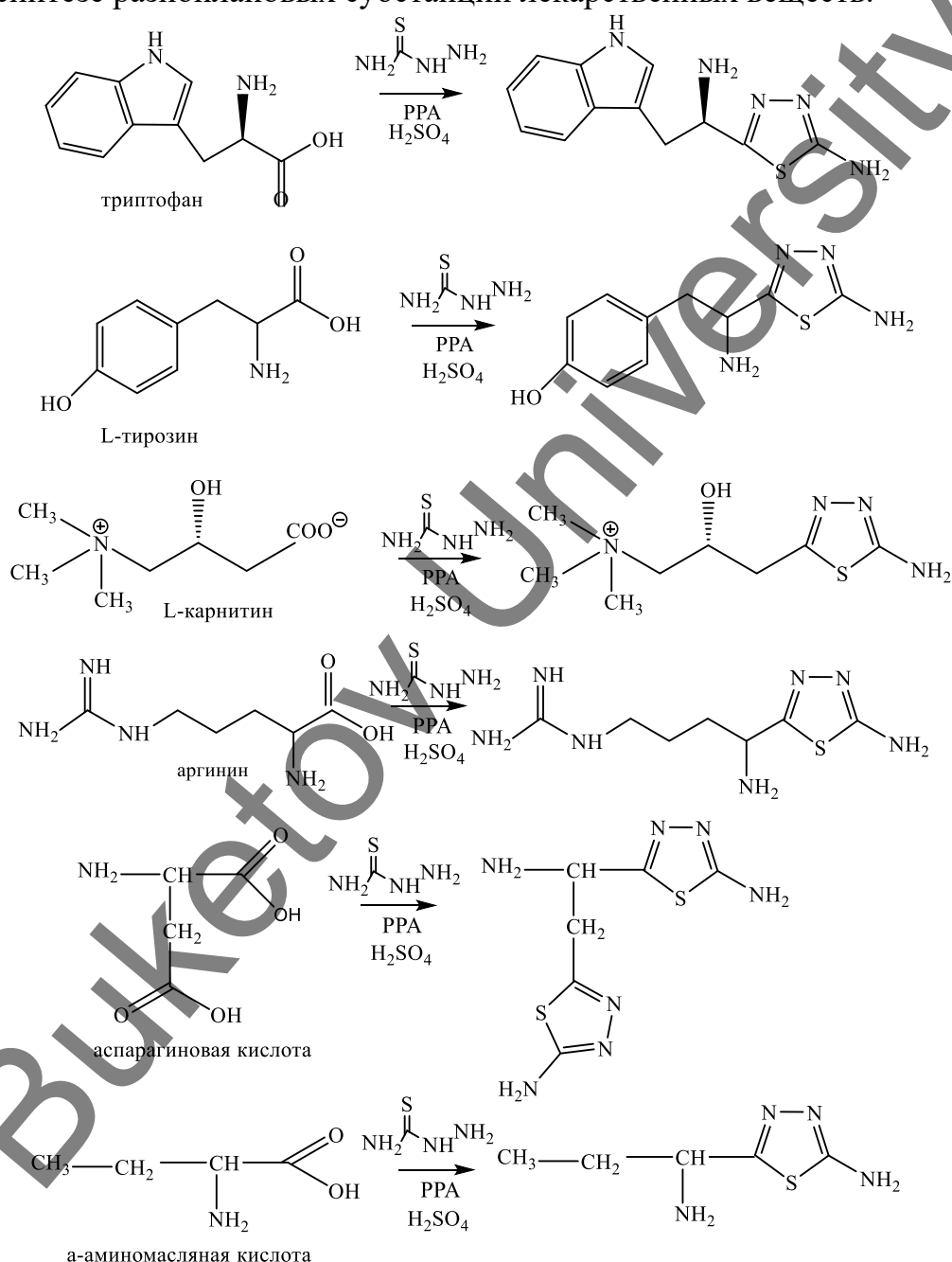
Целью данного исследования является разработка новых субстанций лекарственных препаратов на основе производных тиадиазолов, имеющих значительный потенциал для химической модификации в плане создания новых биологически активных соединений с применением методов виртуального скрининга для предварительного прогнозирования фармакологической активности, а также изучение механизмов реакций и взаимосвязи структура-биоактивность.

Анализ литературных данных и проведенных предварительных исследований по прогнозированию биологической активности планируемых синтезов соединений показал значительную перспективность химической модификации производных тиадиазолов [1-4]. С этой целью нами проведены синтезы ряда тиадиазолов, обладающих значительным потенциалом возможных химических трансформаций, приводящих к перспективным субстанциям лекарственных веществ.

Для синтеза тиадиазолов применяли известную классическую схему синтеза, в которую внесли некоторые корректирующие изменения. Способ получения основан на взаимодействии тиосемикарбазида и карбоновых кислот в присутствии смеси конц. серной кислоты и полифосфорной кислоты (РРА). Было установлено, что наиболее высокий выход дает применение смеси серной и РРА в

соотношении 25% и 75%. В результате проведенных исследований синтезированы тиadiaзолы на основе различных аминокарбоновых кислот: триптофана, L-карнитин, L-тирозин, аспарагиновая кислота, аргинин, α-аминомасляная кислота.

Предлагаемый метод синтеза позволяет получать самые разнообразные производные на основе различных аминокарбоновых кислот. В результате проведенных экспериментов были получены бистиазолы на основе широкого круга аминокарбоновых кислот, представляющих значительный практический интерес в синтезе разноплановых субстанций лекарственных веществ.



Все синтезированные соединения представляют собой светло-желтые или бесцветные кристаллические вещества с четкими температурами плавления. Состав, структура и чистота полученных соединений доказаны современными физико-химическими методами, в том числе данными ИК-спектроскопии,

ВЭЖХ-анализа. Контроль реакции осуществляли методом ТСХ (тонкослойной хроматографии). В ИК-спектрах синтезированных соединений присутствуют валентные колебания, соответствующие следующим группам (cm^{-1}): C-H (2880), NH_2 (3320, 3340).

В результате проведенных исследований был усовершенствован метод синтеза производных тиадиазолов, позволяющий значительно повысить выход целевых продуктов, а, следовательно, эффективно использовать их в качестве синтонов для получения новых субстанций лекарственных препаратов.

Литература

1. Jain, Abhishek Kumar; Sharma, Simant; Vaidya, Ankur; Ravichandran, Veerasamy; Agrawal, Ram Kishore (2013). "1,3,4-Thiadiazole and its Derivatives: A Review on Recent Progress in Biological Activities". *Chemical Biology & Drug Design*.

2. Kadi, A.A., Al-Abdullah, E.S., Shehata, I.A., Habib, E.E., Ibrahim, T.M., El-Emam, A.A. Synthesis, antimicrobial and anti-inflammatory activities of novel 5-(1-adamantyl)-1,3,4-thiadiazole derivatives (2010) 45: 5006-5010.

3. Патент на полезную модель от 20.09.74г. по заявке 2061395/04 Автор: ЭДДИ ВИ-ПИНГ ТАО "Способ получения производных 2-амино-1,3,4-тиадиазола"

4. Ю. В. Суворова, Е. А. Петухова, Е. А. Данилова, Д. В. Тюрин «Синтез и свойства бистиадиазолов с этильным и бутильным спейсерами»(2020).

AZOMETHINES BASED ON 2-AMINOTHIAZOLE AND ITS DERIVATIVES

Salkeyeva L.K., Minayeva Ye.V., Tolepbek I.S., Erzyamkina V.Yu.,
Puchaikina S.V., Shamray D.A., Gammer D.A.
Karaganda University of the name of Academician E.A. Buketov

Thiazole derivatives serve as starting raw material for the production of valuable medicines, namely antibiotics, anti-allergic, anti-inflammatory, anticancer drugs [1-4]. Moreover, some azomethines synthesized based on aminothiazole derivatives possess high antituberculosis activity [5].

The aim of this work was to synthesize new azomethines (7-15) based on substituted benzaldehydes (1-3), 2-aminothiazole (4) and its derivatives (5, 6), as well as to predict the biological activity of the compounds obtained.