

# Облікова картка дисертації

## I. Загальні відомості

**Державний обліковий номер:** 0408U000939

**Особливі позначки:** відкрита

**Дата реєстрації:** 14-03-2008

**Статус:** Захищена

**Реквізити наказу МОН / наказу закладу:**



## II. Відомості про здобувача

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Колесніков Олексій Володимирович

2. Kolesnikov Oleksij Volodymyrovych

**Кваліфікація:**

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Вид дисертації:** кандидат наук

**Аспірантура/Докторантура:** так

**Шифр наукової спеціальності:** 15.00.02

**Назва наукової спеціальності:** Фармацевтична хімія та фармакогнозія

**Галузь / галузі знань:** Не застосовується

**Освітньо-наукова програма зі спеціальності:** Не застосовується

**Дата захисту:** 01-02-2008

**Спеціальність за освітою:**

**Місце роботи здобувача:** Національний фармацевтичний університет

**Код за ЄДРПОУ:** 02010936

**Місцезнаходження:** 61002, м.Харків, вул.Пушкінська, 53

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство охорони здоров'я

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **III. Відомості про організацію, де відбувся захист**

**Шифр спеціалізованої вченої ради (разової спеціалізованої вченої ради):** Д 64.605.01

**Повне найменування юридичної особи:** Національний фармацевтичний університет

**Код за ЄДРПОУ:** 02010936

**Місцезнаходження:** вул. Пушкінська, 53, м. Харків, Харківський р-н., Харківська обл., 61002, Україна

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство охорони здоров'я України

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **IV. Відомості про підприємство, установу, організацію, в якій було виконано дисертацію**

**Повне найменування юридичної особи:** Національний фармацевтичний університет

**Код за ЄДРПОУ:** 02010936

**Місцезнаходження:** 61002, м. Харків, вул. Пушкінська, 53

**Форма власності:**

**Сфера управління:** Міністерство охорони здоров'я

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **V. Відомості про дисертацію**

**Мова дисертації:**

**Коди тематичних рубрик:** 76.31.29

**Тема дисертації:**

1. Синтез, хімічні перетворення та біологічна активність похідних піримідинтіону, хіназолінтіону та піримідо[5,4-d]піримідину
2. Derivatives of a pyrimidinethiones, quinazolinethiones and pyrimido[5,4-d]pyrimidine synthesis, chemical transformation and biological activity

**Реферат:**

1. Синтезовано мало вивчені 4-аміно-5-арилсульфоніл-1Н-піримідинтіони-2 та 4-аміно-5-(2-тієнілсульфоніл)-1Н-піримідинтіони-2, та продукти їх алкілування. Встановлено що для синтезу похідних 4-амінохіназолін-2-тіонів, препаративним методом є взаємодія 2-ізотіоціанобензонітрилів з амінами. Утворення 4-амінохіназолін-2-тіонів відбувається за умов реакції Дімрота. Для розширення класу отриманих сполук було проведено їх алкілування алкілгалогенідами. Для остаточного доведення структури синтезованих сполук, напрямку алкілування та можливості проходження перегрупування Дімрота, було проведено рентгеноструктурне дослідження 2-[(4-нітробензил)сульфаніл]-N-(циклогексил)-4-хіназолінаміну. Для раціонального синтезу 2,4,6,8-тетразаміщених піримідо[5,4-d]пі-ри-мідинів, потенційних міметиків пурину, було вивчено послідовні реакції нуклеофільного заміщення (ТСРР) 2,4,6,8-тетрахлорпіримідо[5,4-d]піримідину. Завдяки використанню комплексних інструментальних методів

дослідження та рентгеноструктурного аналізу ми повністю підтвердили структуру отриманих сполук і довели, що відбувається перегрупування Дімрота та алкілування за атомом сульфуру. За результатами проведеного фармакологічного скринінгу виявлено, що 4-амі-но-5-(2-тієнілсульфоніл)-1Н-піримідинтіон-2-N-о-толілацетамід є відносно не-ток-сичним, та проявляє високий рівень анальгетичної дії яка перевершує анальгетичну активність вольтарена у 9,8 рази та дії на ЦНС. Цю речовину запропоновано для поглибленого фармакологічного до-слідження. На вказану субстанцію розроблено проект АНД.

2. Less studied 4-amino-5-arylsulfonyl-1H-pyrimidinethiones-2 and 4-amino-5-(2-thienylsulfonyl)-1H-pyrimidinethiones-2 and products of their alkylation were synthesized. It has been found that for the synthesis of 4-aminoquinazoline-2-thiones derivatives interaction of 2-isothiocyanobenzonitriles with amines can be used. Formation of an 4-aminoquinazoline-2-thiones takes place under Dymrot's reaction conditions. For expansion of class of the got connections it was conducted them alkilation. For the final leading to of structure of the synthesized connections, direction of alkilations and possibility of passing regrouping of Dymrot's, X-ray analysis. For the rational synthesis of an 2,4,6,8-tetrasubstituted pyrimido[5,4-d]pyrimidines which are potential purine mimetics, subsequent nucleophilic substitution reactions of an 2,4,6,8-tetrasubstituted pyrimido[5,4-d]pyrimidines (TCPP) has been studied. According to the results of the pharmacological screening was observed that 4-amino-5-(2-thienylsulfofnyl)-1H-pyrimidinethione-2-N-o-tolyacetamide is com-parative non-toxic and possess high level analgesic and action on the CNS. This substance is recommended for the further pharmacological studying and project of an analytical and technical documentation for this substance has been developed.

**Державний реєстраційний номер ДіР:**

**Пріоритетний напрям розвитку науки і техніки:**

**Стратегічний пріоритетний напрям інноваційної діяльності:**

**Підсумки дослідження:**

**Публікації:**

**Наукова (науково-технічна) продукція:**

**Соціально-економічна спрямованість:**

**Охоронні документи на ОПВ:**

**Впровадження результатів дисертації:**

**Зв'язок з науковими темами:**

## **VI. Відомості про наукового керівника /керівників (консультанта)**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Коваленко Сергій Миколайович

2. Kovalenko Sergij Mykolajovych

**Кваліфікація:** д.х.н., 15.00.02

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

## **VII. Відомості про офіційних опонентів та рецензентів**

### **Офіційні опоненти**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Болотов Валерій Васильович

2. Болотов Валерій Васильович

**Кваліфікація:** д.х.н., 15.00.02

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові:**

1. Демченко Анатолій Михайлович

2. Демченко Анатолій Михайлович

**Кваліфікація:** д.фарм.н., 15.00.02

**Ідентифікатор ORCID ID:** Не застосовується

**Додаткова інформація:**

**Повне найменування юридичної особи:**

**Код за ЄДРПОУ:**

**Місцезнаходження:**

**Форма власності:**

**Сфера управління:**

**Ідентифікатор ROR:** Не застосовується

### **Рецензенти**

## VIII. **Заключні відомості**

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові  
голови ради**

Гриценко Іван Семенович

**Власне Прізвище Ім'я По-батькові  
головуючого на засіданні**

Гриценко Іван Семенович

**Відповідальний за підготовку  
облікових документів**

**Реєстратор**

**Керівник відділу УкрІНТЕІ, що є  
відповідальним за реєстрацію наукової  
діяльності**



Юрченко Т.А.