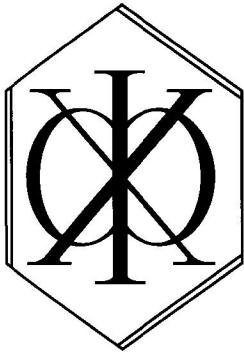


# Химико-фармацевтический журнал



МОСКВА • ФОЛИУМ • 2017

1



# Химико-фармацевтический журнал

2017 Том 51

№ 1

ЕЖЕМЕСЯЧНЫЙ НАУЧНО-ТЕХНИЧЕСКИЙ И ПРОИЗВОДСТВЕННЫЙ ЖУРНАЛ  
Основан в январе 1967 г.

## РЕДАКЦИОННАЯ КОЛЛЕГИЯ

Главный редактор

**Н. Л. Шимановский**

В. А. Быков

М. С. Гойzman

Т. А. Гуськова

И. С. Гущин

Н. Б. Демина

И. А. Ленева

В. В. Поройков

Г. В. Раменская (заместитель  
главного редактора)

С. Б. Середенин

Т. А. Сокольская

А. М. Юркевич

Зав. редакцией:

М. И. Горюн

## АДРЕС РЕДАКЦИИ

Москва, Дмитровское шоссе, 157

Адрес для переписки:

127238, Москва, а/я 42

Тел.: +7(499) 258-0828, доб. 18

E-mail: chem@folium.ru

Интернет: chem.folium.ru

## ИЗДАТЕЛЬ

Издательский дом «Фолиум»

## АДРЕС ИЗДАТЕЛЬСТВА

Россия, 127411, Москва,  
Дмитровское шоссе, 157

Тел.: +7 (499) 258-0828

info@folium.ru

www.folium.ru

Подписано в печать 03.02.2017

Формат 60 × 80 1/8

Оригинал-макет выполнен  
в издательстве «Фолиум»

## Содержание

### Молекулярно-биологические проблемы создания лекарственных средств и изучение механизма их действия

- Спасов А. А., Яковлев Д. С., Бригадирова А. А. Ангиотензиновые AT<sub>1</sub>-рецепторы и их лиганды (обзор) . . . . . 3

### Поиск новых лекарственных средств

- Сидорова Л. П., Цейтлер Т. А., Емельянов В. В., Саватеева Е. А., Максимова Н. Е., Мочульская Н. Н., Черешнев В. А., Чупахин О. Н. 2-Тиоморфолино-5-арил-6Н-1,3,4-тиадиазин гидробромиды и их способность к ингибированию неферментативного гликозилирования белков. . . . . 11

- Климочкин Ю. Н., Моисеев И. К., Леонова М. В., Николаева С. Н., Бореко Е. И. Синтез и противовирусные свойства этил(3-этилладамант-1-ил)карбамата. . . . . 15

- Сурикова О. В., Юсов А. С., Махмудов Р. Р., Михайлловский А. Г. Синтез и анальгетическая активность 1-замещенных 3-метил-6-метокси-7-(n-бутокси)-3,4-дигидроизохинолина . . . . . 20

- Сурикова О. В., Михайлловский А. Г., Сыропятов Б. Я., Юсов А. С., Худякова Ю. Д. Синтез, антигельминтная и инсектицидная активность амидов 2-[3-метил-6-метокси-7-(n-пропокси)-3,4-дигидроизохинолин-1]-этановой кислоты. . . . . 23

- Сайдов Н. Б., Георгянц В. А., Липакова Е. Ю. Синтез и фармакологический потенциал новых производных 3-меркапто-4-амино(пирролил-1)-5-(тиенил-2)-1,2,4-триазола(4H) . . . . . 27

- Геворгян Г. А., Гаспарян Н. К., Патоян О. А., Тумаджян А. Е., Татевосян А. А., Паносян Г. А. Синтез и некоторые биологические свойства дигидрохлоридов 3-(4-бензилпiperазино)-1-(4-этоксифенил)-1-алкил(арил)-2-фенилпропан-1-олов . . . . . 31

- Полищук П. Г., Косинская А. П., Ларионов В. Б., Огниченко Л. Н., Кузьмин В. Е., Головенко Н. Я. Ранжированный ряд фрагментов молекул лекарственных средств, определяющих их нейродоступность . . . . . 35

### Лекарственные растения

- Бабкин В. А., Остроухова Л. А., Левчук А. А., Онучина Н. А. Влияние условий экстракции на выход нативного дигидрокверцетина, содержащего более 97 % (+)-2R,3R-трансизомера . . . . . 39

### Методы синтеза и технология производства лекарственных средств

- Украинец И. В., Гриневич Л. А., Алексеева Т. В. Синтез и строение этилового эфира 7-гидрокси-5-оксо-2,3-дигидро-5Н-[1,3]тиазоло[3,2-а]пиримидин-6-карбоновой кислоты . . . . . 42

- Пенкина Ю. А., Павловская О. П., Авраменко Г. В. Разработка микрокапсулированной лекарственной формы винпоцетина для ингаляционного введения . . . . . 46

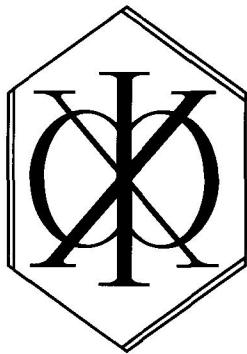
- Степанов В. А., Бугатов В. В. Получение липосомальных форм ряда пиразолусульфохлоридов и пиперазинкарбоксилатов . . . . . 51

### Исследование строения химических соединений, методы анализа и контроль производства

- Гунар О. В., Буйлова И. А. Особенности валидации качественных микробиологических методов фармацевтического анализа . . . . . 54

Журнал входит в Перечень ведущих рецензируемых научных журналов и изданий, рекомендованных ВАК РФ для публикации основных научных результатов диссертаций на соискание ученых степеней доктора и кандидата наук.

Перепечатка материалов из «Химико-фармацевтического журнала» возможна при обязательном согласовании с редакцией журнала. При перепечатке материалов ссылка на «Химико-фармацевтический журнал» обязательна.



# Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal

2017 Vol. 51

№ 1

MONTHLY SCIENTIFIC-TECHNICAL AND INDUSTRIAL JOURNAL  
Established January 1967

## EDITORIAL BOARD

Editor-in-Chief

N. L. Shimanovskii

V. A. Bykov

M. S. Goizman

T. A. Gus'kova

I. S. Gushchin

N. B. Demina

I. A. Leneva

V. V. Poroikov

G. V. Ramenskaya

S. B. Seredenin

T. A. Sokol'skaya

A. M. Yurkevich

Deputy Editor-in-Chief

M. I. Goryun

## EDITORIAL'S ADDRESS

157 Dmitrovskoe shosse,  
Moscow, 127411, Russia

Address for correspondence:  
127238, Moscow, P.O.Box 42

Tel.: +7(499) 258-0828, ext. 18

E-mail: chem@folium.ru

Internet: chem.folium.ru

## PUBLISHER

Folium Publishing House

## PUBLISHER'S ADDRESS

157 Dmitrovskoe shosse,  
Moscow, 127411, Russia

Tel.: +7 (499) 258-0828

info@folium.ru

www.folium.ru

Printed by Folium Publishing House

## Contents

### Molecular-biological problems of drug design and mechanism of drug action

- Spasov A. A., Yakovlev D. S., and Brigadirova A. A. Angiotensin AT1 Receptors and Their Ligands (A Review) . . . . . 3

### Search for new drugs

- Sidorova L. P., Tseitler T. A., Emel'yanov V. V., Savateeva E. A., Maksimova N. E., Mochul'skaya N. N., Chereshnev V. A., and Chupakhin O. N. Synthesis of 2-Thiomorpholino-5-aryl-6H-1,3,4-thiadiazine Hydrobromides and Study of Their Ability to Inhibit Nonenzymatic Glycosylation of Proteins . . . . . 11

- Klimochkin Yu. N., Moiseev I. K., Leonova M. V., Nikolaeva S. N., and Boreko E. I. Synthesis and Antiviral Properties of Ethyl(3-ethyladamant-1-yl)carbamate . . . . . 15

- Surikova O. V., Yusov A. S., Makhmudov R. R., and Mikhailovskii A. G. Synthesis and Analgesic Activity of 1-Substituted 3-Methyl-6-methoxy-7-(n-butoxy)-3,4-dihydroisoquinoline . . . . . 20

- Surikova O. V., Mikhailovskii A. G., Syropyatov B. Ya., Yusov A. S., and Khudyakova Yu. D. Synthesis, Anthelmintic and Insecticide Activities of 2-(6-Methoxy-3-methyl-7-(n-propoxy)-3,4-dihydroisoquinol-1-yl)-ethanoic Acid Amides . . . . . 23

- Saidov N. B., Georgiyants V. A., and Lipakova E. Yu. Synthesis of New Derivatives of 3-Mercapto-4-amino(pyrrolyl-1)-5-(tiemyl-2)-1,2,4-triazole (4H) and Their Pharmacological Potential . . . . . 27

- Gevorgyan G. A., Papoyan O. A., Gasparyan N. K., Paronikyan R. G., Tatevosyan A. A., and Panosyan H. A. Synthesis and Some Biological Properties of 3-(Benzylpiperazin-1-yl)-1-[(4-ethoxyphenyl)-1-alkyl(aryl)-2-phenylpropan-1-ols] . . . . . 31

- Polishchuk P. G., Kosinskaya A. P., Larionov V. B., Ognichenko L. N., Kuz'min V. E., and Golovenko N. Ya. Ranked Series of Molecular Fragments Defining Neuroavailability of Drugs . . . . . 35

### Medicinal plants

- Babkin V. A., Ostroukhova L. A., Levchuk A. A., and Onuchina N. A. Influence of Extraction Conditions on the Yield of Native Dihydroquercetin Containing More than 97% of (+)-2R,3R-trans Isomer . . . . . 39

### Drug synthesis methods and manufacturing technology

- Ukrainets I. V., Grinevich L. A., and Alekseeva T. V. Synthesis and Structure of Ethyl 7-Hydroxy-5-oxo-2,3-dihydro-5H-[1,3]thiazolo[3,2-a]pyrimidine-6-carboxylate . . . . . 42

- Penkina Yu. A., Pavlovskaya O. P., and Avramenko G. V. Development of Microencapsulated Vinpocetine Dosage Form for Pulmonary Administration . . . . . 46

- Stepanov V. A. and Bulatov V. V. Manufacturing Liposomal Forms of Pyrazole Sulfochlorides and Piperazine Carboxylates . . . . . 51

### Structure of chemical compounds, methods of analysis and process control

- Gunar O. V. and Builova I. A. Peculiarities of the Validation of Qualitative Microbiological Methods for Pharmaceutical Analysis . . . . . 54

This journal enters into the List of Leading Peer-Reviewed Scientific Journals and Editions recommended by the Higher Attestation Commission (VAK) of the Russian Federation for publication of the main scientific results of dissertations in seeking for degrees of the Doctor of Science and Candidate of Science.

Reproduction of materials from *Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal* is possible upon obligatory agreement with the Editorial Office of the journal. In case of material reproduction, the reference to *Khimiko-Farmatsevticheskii Zhurnal* is obligatory.