**Щегравина, Екатерина Сергеевна.**

## Новые нерацемические гетероциклические аллоколхициноиды и наночастицы на их основе : дизайн, синтез, противоопухолевая активность : диссертация ... кандидата химических наук : 02.00.03 / Щегравина Екатерина Сергеевна; [Место защиты: Национальный исследовательский Нижегородский государственный университет им. Н.И. Лобачевского]. - Нижний Новгород, 2019. - 191 с. : ил.

## Оглавление диссертациикандидат наук Щегравина Екатерина Сергеевна

Список сокращений

Введение

Литературный обзор

1. Введение

2. Мишени для химиотерапии

3. Тубулин как мишень для химиотерапии

4. Классификация ингибиторов тубулина, их основные характеристики и механизм действия

5. Колхициновый сайт: структура, лиганды сайта

6. Структура колхицина и ее модификации

6.1 Модификации колхицина по кольцу А

6.2. Модификации колхицина по кольцу В

6.3 Модификации колхицина по кольцу С и Б

6.4 Модификации колхицина по боковым цепям

6.5 Гибриды и пролекарства на основе колхицина

7. Заключение

Обоснование диссертационных исследований

Обсуждение результатов

1. Синтез и биологическая активность пирролоаллоколхициноидов

2. Синтез и биологическая активность пирролоаллоколхициноидов II

3. Синтез и биологическая активность аллоколхициноидов III

4. Синтез и биологическая активность колхициноидов IV

5. Синтез липидных пролекарств на основе колхициноидов и их включение в состав терапевтических липосом

ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

1. Общие сведения

2. Синтез аллоколхициноидов I

3. Синтез аллоколхициноидов II

4. Синтез аллоколхициноидов III

5. Синтез алоколхициноидов IV

6. Синтез липидных пролекарственных форм

7. Квантовые расчеты

8. Профиль поверхностного натяжения монослоев

9. Приготовление липидных монослойных пленок

10. Липосомы

10.1 Приготовление липосом

10.2 Определение дзета-потенциала

10.3 Динамическое светорассеивание

10.4. Гидролиз фосфолипазой А2

11. Биологические исследования in vitro

ВЫВОДЫ

БЛАГОДАРНОСТИ

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

Список сокращений

1,2-DCE - 1,2-дихлорэтан Boc - трет-бутоксикарбонил

BOPCl - бис(2-оксо-2-оксазолидинил)фосфинхлорид

СА-4 - комбретастатин А-4

CA-4P - фосфат комбретастатина А-4

COD - циклооктадиен

m-CPBA - жета-хлорпербензойная кислота CPME - метилциклопропиловый эфир Cp\* - 1,2,3,4,5 - пентаметилциклопентадиен DABCO - 1,4-диазабицикло[2.2.2]октан dba - дибензилиденацетон

DBU - диазабициклоундецен (1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен)

DIPEA - диизопропилэтиламин

DMAP - N^-диметиламинопиридин

DMF (ДМФА) - диметилформамид

DPE-phos - 2-(дифенилфосфино)фениловый эфир

dppe - 1,2-бис(дифенилфосфино)этан

dppf - 1,1 '-бис(дифенилфосфино)ферроцен

dppp - 1,2-бис(дифенилфосфино)пропан

JohnPhos - 2-(ди-трет-бутилфосфино)бифенил

LDA - диизопропиламид лития

MALDI - матрично-активированная лазерная десорбция/ионизация

MOM - метоксиметил

MsCl - метансульфонилхлорид

NBS - N-бромсукцинимид

NIS - N-йодсукцинимид

OTf - трифторметансульфонат

TBAF - тетрабутиламмоний фторид

TBS - трет-бутилдиметилсилил

TFA - трифторуксусная кислота

TMS - триметилсилил

Ts - тозил (пара-толуолсульфанил)

THF (ТГФ) - тетрагидрофуран

S-Phos - 2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметоксидифенил

9-ББН - 9-боробицикло[3.3.1]нонан

ДАК - динитрил азобисизомасляной кислоты

ДИБАЛ-Н - диизобутилалюминийгидрид

ДМСО - диметилсульфоксид

КХ - колоночная хроматография

МТБЭ - метил-трет-бутиловый эфир

МТТ - тетразолиевый краситель 3-(4,5-диметилтиазол-2-ил)-2,5-дифенил-тетразолиум бромид

ТСХ - тонкослойная хроматография ЯМР - ядерный магнитный резонанс

Введение