

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ**

**Державний вищий навчальний заклад  
«Тернопільський держаний медичний університет  
імені І.Я. Горбачевського»**

**III Всеукраїнська науково-практична  
конференція**

**«ХІМІЯ ПРИРОДНИХ СПОЛУК»**

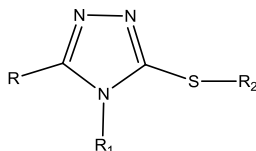


**30-31 жовтня 2012 року**

**Тернопіль**  
**«Укрмедкнига»**  
**2012**

синтетичних анальгетиків, з мінімальною кількістю побічних ефектів та низькою токсичністю, є актуальним і обґрунтованим.

Метою нашої роботи є дослідження анальгетичної активності в ряду похідних 2-(4-R<sub>1</sub>-5-R-1,2,4-тріазол-3-ілтіо)ацетальдегіду, які синтезовані на кафедрі токсикологічної і неорганічної хімії ЗДМУ (зав. каф. д. фарм. н., професор О. І. Панасенко). Загальні формули досліджуваних сполук представлені нижче.



де, R-H, CH<sub>3</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>; R<sub>1</sub>-H, CH<sub>3</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>; R<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-COH; Het-O-C(O)CH<sub>3</sub>; -CH<sub>2</sub>-CH=N-N=CH-CH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>N<sub>3</sub>-4-R-5-R<sub>1</sub>; -CH<sub>2</sub>-CH=N-N-H<sub>2</sub>, Alk, Ar; -CH<sub>2</sub>-CH=N-N-C(O)-H, Alk, Ar, Het; -CH<sub>2</sub>-CH=N-N-C(O)-NH-H, Alk, Ar; -CH<sub>2</sub>-CH=N-N-C(S)-NH-H, Alk, Het, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-OH; -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-Alk, Ar; -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-C(O)-Alk, Ar; -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-Cl.

Дослідження проведено на групі білих нелінійних щурів обох статей вагою 160-230 г. При вивченні анальгетичної активності була використана класична скринінгова модель «оцтовокислих корчів» (Стефанов О. В., 2011). Корчі викликали 0,6% розчином оцтової кислоти з розрахунку 0,1 мл на 10 г маси тварини, який вводили внутрішньочеревно через 10 хв після введення досліджуваних речовин. Кількість корчів підраховували через 15 хв після введення оцтової кислоти на протязі 30 хв.

Анальгетичну активність оцінювали за здатністю речовини зменшувати кількість корчів у дослідній групі тварин порівняно з контрольною і виражали у відсотках.

В результаті дослідження знайдені сполуки, анальгетична дія яких наближається до еталону порівняння анальгину, але за силою дії не перевищують його. Зважаючи на отримані результати пошук потенційних анальгетиків у ряду похідних 2-(4-R<sub>1</sub>-5-R-1,2,4-тріазол-3-ілтіо)ацетальдегіду продовжується.

## СИНТЕЗ, ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ ЕСТЕРІВ 8-БРОМОКСАНТИНІЛ-7-АЛКАНОВИХ КИСЛОТ

Юрченко Д. М., Назаренко М. В., Романенко М. І., Александрова К. В., Самура Б. А.

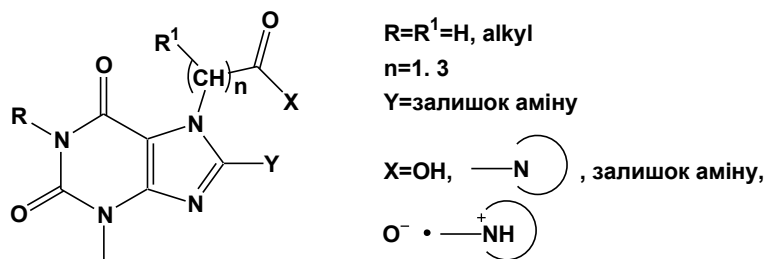
*Запорізький державний медичний університет*

Пошук сполук з антиоксидантною дією для лікування порушень мозкового кровообігу серед похідних ксантиніл-7-алканових кислот є актуальною задачею фармацевтичної хімії, оскільки на сьогоднішній день відсутні препарати, які б одночасно були ефективними, малотоксичними та не проявляли побічних ефектів.

Метою даної роботи є пошук нових біологічно активних сполук в ряду похідних ксантину, які можуть знайти застосування в практичній медицині в якості лікарських засобів.

Вихідні естери 8-бромоксантиніл-7-алканових кислот отримували взаємодією 8-бромоксантинів з естерами α- та β-галогеналканових кислот в диметилформаміді у присутності натрію гідрокарбонату. В результаті вивчення реакцій естерів ксантиніл-7-алканових кислот з первинними аліфатичними амінами встановлено, що будова продуктів залежить від основності аміну, розчинника та температурних умов. Проведені дослідження

дозволили синтезувати ряд неописаних раніше 8-аміноксантиніл-7-алканових кислот, їх амонійних солей та амідів загальної формули:



Будова всіх синтезованих речовин доведена даними елементного аналізу, ІЧ-, ПМР-спектроскопії та мас-спектрометрії, а індивідуальність підтверджена методом тонкошарової хроматографії.

Первинний фармакологічний скринінг підтвердив перспективність пошуку сполук з антиоксидантною, нейропротективною та діуретичною діями серед естерів 8-бромксантиніл-7-алканових кислот. Отримані результати дали змогу встановити деякі кореляційні залежності між будовою молекули та біологічною дією.