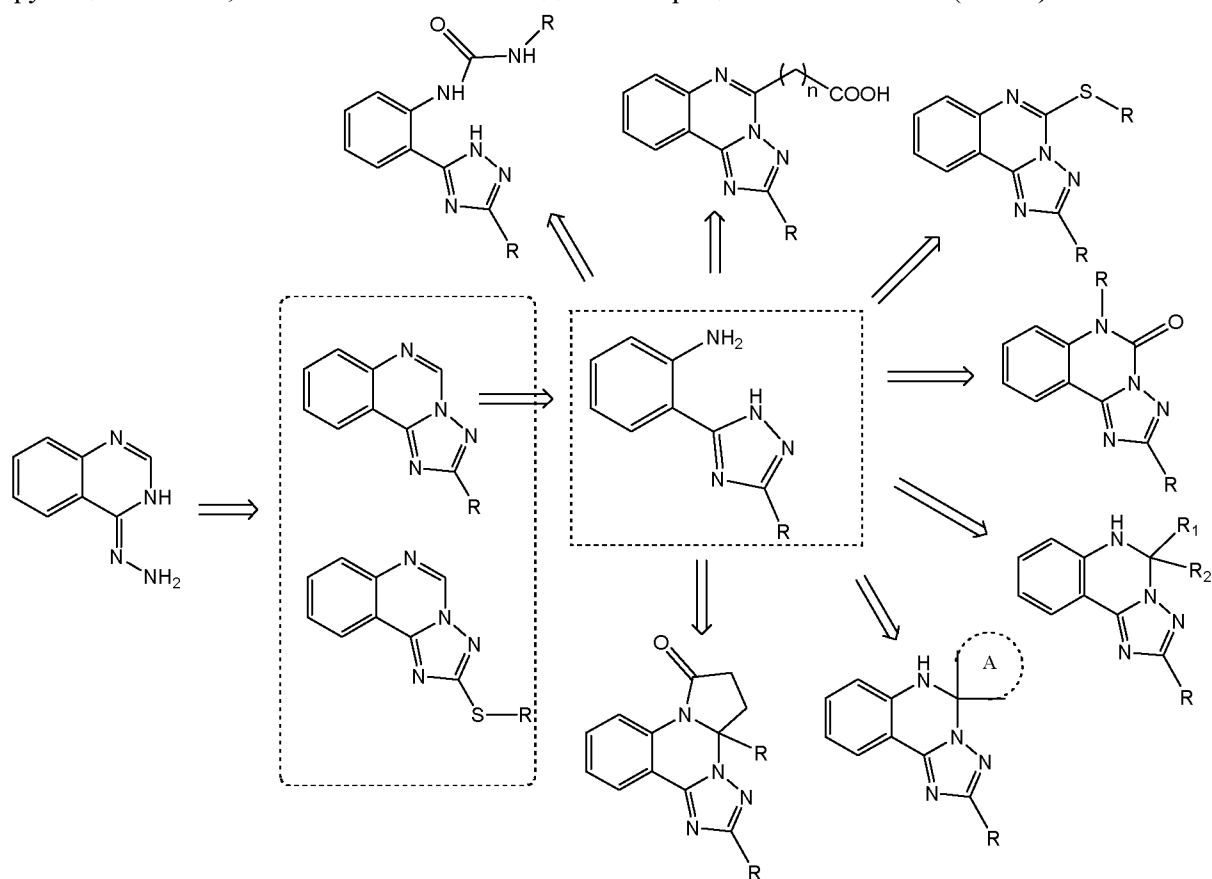


ЗАМІЩЕНІ [1,2,4]ТРИАЗОЛО[1,5-*c*]ХІНАЗОЛІНИ – ПЕРСПЕКТИВНИЙ КЛАС БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН

Шабельник К. П., Мартиненко Ю. В., Холодняк С. В., Білий А. К.,
Антипенко Л. М., Коваленко С. І.

Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя, Україна
e-mail: kovalenkosergiy@gmail.com

Синтетичні можливості модифікації 4-гідразинохіназолінів дозволяють розглядати їх як ефективні прекурсори для побудови нових гетероциклічних систем. Так, використання зазначеного прекурсору у реакціях [4+2]-циклоконденсації дозволило синтезувати цілі ряди 2-заміщених [1,2,4]триазоло[1,5-*c*]хіназолінів. Продукти їх модифікації, а саме 2-(3-*R*-1*H*-1,2,4-триазол)аніліни виявились цікавими об'єктами в плані їх утилізації у реакціях [5+1]-циклоконденсації з різноманітними моно- та діелектрофільними реагентами. За даним підходом синтезований цілий клас невідомих як функціональних, так і анельованих похідних гетероциклічних систем (схема).



Аналіз зазначених структур із використанням сучасних підходів до пошуку БАР (докінг, QSAR-, SAR-аналіз, концепції оптимізації «структури-лідера») та класичного фармакологічного скринінгу дозволили виявити серед них різноманітні види біологічної дії. Встановлено, що синтезовані сполуки проявляють високу гіпоглімімічну активність, противосудомну, нейропротекторну, антиоксидантну, антигіпоксичну, аналгетичну, протизапальну, антинабрякову, протимікробну, протигрибкову, протиракову та інші види активності. Результати біологічних досліджень дозволили ряд «сполук-лідерів» як перспективних об'єктів для поглибленого фармакологічного вивчення, так і спланувати подальшу стратегію пошуку на основі кореляційної залежності «структура-активність».