

As a logical extension of our previous studies we investigated nine compounds having purine-2,6-dione core with different pharmacophores. To evaluate diuretic activity of synthesized compounds we used white rats 125-180 g.

LD<sub>50</sub> of investigating compounds lies within 385–1170 mg/kg. Obtained data gives us the possibility to suppose that synthesized compounds have high diuretic activity in comparison with hypothiazide.

Structures of synthesized compounds were confirmed by IR-, NMR-spectroscopy and mass-spectrometry.

## СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ ВЛАСТИВОСТЕЙ ПОХІДНИХ 4-ФЕНІЛ-5-(ПІРОЛ-2-ІЛ)-1,2,4-ТІАЗОЛ-3-ТІОЛУ

Верба Д.П.

Науковий керівник: к.фарм.н. Гоцуля А.С.  
Запорізький державний медичний університет  
Кафедра токсикологічної та неорганічної хімії

Похідні 1,2,4-тріазолу знаходять широке розповсюдження серед науковців зі всього світу через високу реакційну здатність, низку токсичність та високу біологічну здатність.

**Мета роботи.** Синтезувати 4-феніл-5-(пірол-2-іл)-1,2,4-тріазол-3-тіол, отримати ряд тіопохідних, підтвердити їх структуру, вивчити гостру токсичність, протимікробну та актопротекторну активність.

**Матеріали та методи.** За вихідну сполуку був взятий пірол, з якого через ряд послідовних реакцій (ацилювання, гіdraзиноліз, реакція A<sub>N</sub>, гетероциклізація) був отриман 4-феніл-5-(пірол-2-іл)-1,2,4-тріазол-3-тіол. Згодом, тіол піддавали реакціям S<sub>E</sub> алкілюючими регентами. Отримували також 2-(4-феніл-5-(пірол-2-іл)-1,2,4-тріазол-3-ілтіо)ацетатну кислоту і ряд органічних та неорганічних солей. Проводили сучасні фізико-хімічні методи аналізу для підтвердження структури отриманих сполук та вивчали протимікробну і актопротекторну активність.

**Результати та їх обговорення.** Отримано 18 амідів, 10 алкілпохідних, та 12 солей. Підтверджена їх структура, вивчена гостра токсичність, актопротекторна та протимікробна активності.

**Висновок.** Отримано 30 похідних 4-феніл-5-(пірол-2-іл)-1,2,4-тріазол-3-тіолу. Майже всі сполуки виявляють помірну токсичність, та відносяться до класу малотоксичних та майже нетоксичних. Дві сполуки виявляють виражену протимікробну активність.

## РЕОЛОГИЧЕСКИЕ ИССЛЕДОВАНИЯ ШАМПУНЯ ГЕЛЕОБРАЗНОГО С МИНОКСИДИЛОМ

Гнитько И.В., Гладышева С.А.

Научный руководитель: проф. Гладышев В.В.  
Запорожский государственный медицинский университет  
Кафедра технологии лекарств

На кафедре технологии лекарств Запорожского медицинского университета на основании комплексных биофармацевтических, физико-химических и микробиологических исследований разработан гелеобразный шампунь, содержащий 1% миноксидила на комплексной основе анионактивного, неионогенного, амфотерного поверхностно-активных веществ, обеспечивающих его высокие пенообразующие свойства. Целью настоящей работы является реологическое изучение структурно-механических свойств разработанной гелеобразной пеномощей композиции для волос с миноксидилом для комплексной терапии и профилактики алопеции.

Изучение структурно-механических характеристик композиций проводили при помощи ротационного вискозиметра "Реотест-2" с цилиндрическим устройством. Для установления консистентных свойств системы навески исследуемых композиций помещали в измерительное устройство и термостатировали в течение получаса при температуре 20°C. Затем цилиндр вращали в измерительном устройстве при двенадцати последовательно увеличивающихся скоростях сдвига, регистрируя показатели индикаторного прибора на каждой ступени. Разрушение структур изучаемых систем проводили путем вращения цилиндра в измерительном устройстве на максимальной скорости в течение 10 минут, после чего, остановив вращение прибора на 10 минут, регистрируя показания индикатора на каждой из двенадцати скоростей сдвига при их уменьшении. На основании

полученных результатов рассчитывали величины предельного напряжения сдвига и эффективной вязкости и строили реограммы течения систем.

В результате проведенных реологических исследований выявлено, что консистентные свойства гелеобразного шампуня с миноксидилом 1% и значение «механической стабильности» системы (1,70) характеризуют ее как исключительно тиксотропную, обеспечивающую восстанавливаемость после механических нагрузок и позволяет прогнозировать стабильность консистентных свойств композиции при длительном хранении. Рассчитанные значения коэффициентов динамического течения шампуня с миноксидилом на гелевой основе ( $Kd_1=38,9\%$ ;  $Kd_2=78,06\%$ ) количественно подтверждают удовлетворительную степень распределения системы во время нанесения на кожные покровы волосистой части головы или во время технологических операций изготовления. Незначительные расхождения между реологическими показателями гелеобразного шампуня с миноксидилом 1% и его основы указывают на отсутствие взаимодействия между действующим веществом и носителем.

## СИНТЕЗ, ВИВЧЕННЯ ФІЗИКО-ХІМІЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ І МЕТОДІВ ІДЕНТИФІКАЦІЇ ТА КІЛЬКІСНОГО ВМІСТУ 5-((1Н-тетразол-1-іл)метіл)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОЛІВ

Гуліна Ю.С.

Науковий керівник д.фарм.н., доц. Каплаушенко А.Г.

Запорізький державний медичний університет

Кафедра фізикоїдної хімії

В останні роки опубліковано безліч робіт з хімії похідних тетразолу, які широко вивчають у зв'язку з їх функціональністю і різноманітним спектром практичного застосування. Особливий інтерес вчених обумовлений, в першу чергу, широким колом фармакологічної активності. У ряду похідних тетразолу виявлені потенційні противірусні, протизапальні, протиастматичні, анальгетичні, протигрибкові та інші засоби. Крім того, в медичній практиці вже застосовуються препарати, діючою речовиною яких є похідні тетразолу, наприклад, Losartan і його аналоги (Ripisartan, Valsartan) – антагоністи ангіотензину, Latamoxef – антибіотик цефалоспоринового ряду.

1,2,3-триазол відносяться до важливого класу гетероциклічних сполук, що представляють як теоретичний, так і практичний інтерес. Вони відомі вже більше 150 років, однак протягом останніх десятиліть 1,2,3-триазолу знову стали одним з найбільш привабливих об'єктів дослідження в хімії завдяки їх фармакологічним властивостям.

Тому розробка методів отримання нових сполук, а також вивчення їх фізико-хімічних та фармакологічних властивостей, які містять тетразол та триазол, залишається актуальною.

Метою нашої роботи є синтез нових малотоксичних і високоефективних речовин 5-((1Н-тетразол-1-іл)метіл)-4-R<sub>1</sub>-1,2,4-триазол-3-тіолів з різними видами біологічної активності, вивчення їх фізико-хімічних властивостей та встановлення закономірностей між хімічною будовою і фармакологічною дією сполук.

На сьогоднішній день проведено синтез нітрилів. Як вихідний реагент використовували отримані раніше вихідні речовини, а саме: 3-((1Н-тетразол-1-іл)метіл)-1,2,4-триазол-3-тіол, 5-((1Н-тетразол-1-іл)метіл)-4-метіл-1,2,4-триазол-3-тіол та 5-((1Н-тетразол-1-іл)метіл)-4-феніл-1,2,4-триазол-3-тіол. Нагріванням вищезазначених речовин з галогеннітрилами різної будови у лужному середовищі були отримані відповідні нітрили. Синтезовані сполуки отримані з досить високими виходами. Структура підтверджена сучасними інструментальними методами аналізу.

В подальшому планується отримання відповідних кислот кислотним та лужним гідролізом, що дасть змогу розширити ряд потенційних біологічно активних речовин.

## ЗАСТОСУВАННЯ ТВЕРДОФАЗНОЇ ЕКСТРАКЦІЇ ДЛЯ ВИДІЛЕННЯ СЕРТИНДОЛУ З СЕЧІ

Давидович С.І.

Науковий керівник: доц. Галькевич І.Й.

Львівський національний медичний університет імені Данила Галицького

Кафедра аналітичної та токсикологічної хімії

**Вступ.** Сертиндол, 1-(2-(4-(5-хлоро-1-(4-фторфеніл)-1Н-індол-3-іл)-1-піперіденіл)етил)-2-імідазолідинон, широко використовується при лікуванні шизофренії. Однак при прийомі високої дози сертиндолу виникають токсичні ефекти, які іноді стають причиною смертельних отруєнь.

**Мета.** Розробка експрес-методики ізолювання сертиндолу з сечі людини при проведенні лабораторних та хіміко-токсикологічних досліджень.