

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я
ЗАПОРІЗЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ**

**ВСЕУКРАЇНСЬКА НАУКОВО-ПРАКТИЧНА
КОНФЕРЕНЦІЯ**

**АКТУАЛЬНІ ПИТАННЯ СУЧАСНОЇ
МЕДИЦИНИ І ФАРМАЦІЇ**

(ДО 50-РІЧЧЯ ЗАСНУВАННЯ ЗДМУ)

ТЕЗИ ДОПОВІДЕЙ

18 – 25 КВІТНЯ 2018 р.

30 ТРАВНЯ 2018 р.

М. ЗАПОРІЖЖЯ

ОРГАНІЗАЦІЙНИЙ КОМІТЕТ

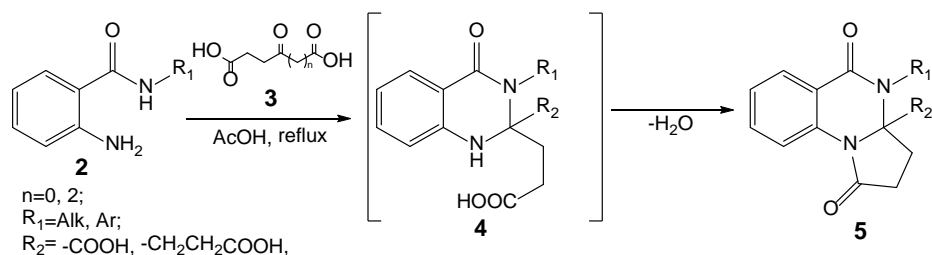
Голова оргкомітету: ректор Запорізького державного медичного університету, **проф. Колесник Ю.М.**

Заступники голови: проф. Туманський В.О., доц. Авраменко М.О.

Члени оргкомітету: проф. Візір В.А.; доц. Моргунцова С.А.; доц. Компанієць В.М.; доц. Кремзер О.А., д.біол.н., доц. Павлов С.В., доц. Полковніков Ю.Ф.; д.мед.н., доц. Разнатовська О.М.; доц. Шишкін М.А.

Секретаріат: Підкович Н.В.; Баранова Н.В.

.....



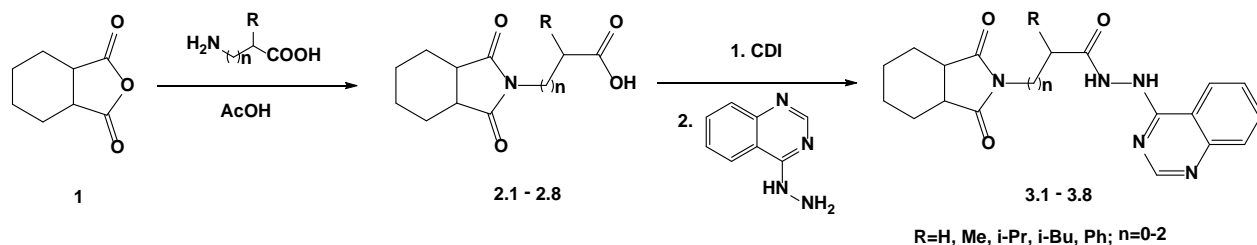
Взаємодія зазначених реагентів в більш м'яких умовах може дати можливість отримати проміжні адукти (4), які утворюються у результаті серії реакцій нуклеофільного приєднання, з метою їх подальшої модифікації.

Після верифікації структур за допомогою фізико-хімічних методів, синтезовані сполуки планують дослідити на наявність антиексудативної дії. Данні первинного фармакологічного скринінгу дозволять зробити висновки про перспективність пошуку протизапальних препаратів серед зазначених сполук, а також визначитись з напрямками подальших досліджень.

N-ЗАХИЩЕНІ АМІНОКИСЛОТИ З ІЗОІНДОЛІНОВИМ ТА ХІНАЗОЛІНОВИМ ФРАГМЕНТАМИ ЯК НОСІЇ ГІПОГЛІКЕМІЧНОЇ ДІЇ

Коваленко С. І., Казунін М. С., Селіванова Є. А., Мартиненко Ю. В.
 Запорізький державний медичний університет

Відомо, що амінокислоти мають широкий спектр біологічної дії. Їх фрагменти входять до складу відомих гіпоглікемічних засобів таких як репаглілід, натеглілід, мітіглілід, тощо. Підвищення рівня глюкози в крові у період після прийому їжі (постпрандіальна гікемія) є самостійним і дуже важливим чинником ризику розвитку судинних ускладнень при цукровому діабеті другого типу. З урахуванням цього розроблені короткодійчі прандіальні регулятори глікемії (меглітініди), механізм дії яких спрямований на стимулювання секреції інсуліну впродовж короткого проміжку часу. Не зважаючи на активність меглітінідів для них характерне зменшення вмісту глікогемоглобіну та ризик підвищення маси тіла. Вирішення цієї проблеми можливо тільки шляхом створення більш ефективних препаратів серед різних класів гетероциклічних сполук, комбінованих препаратів або препаратів, які б поєднували відомі антидіабетичні «фармакофорні» фрагменти, що здатні були забезпечувати довготривалий гіпоглікемічний ефект та мали полівекторний механізм дії. Виходячи з вищевказаного нас зацікавило поєднання в одній молекулі декількох «фармакофорних» фрагментів а саме амінокислотного, тетрагідроізоіндолінового та хіназолінового залишків. Метою роботи є спрямований пошук гіпоглікемічних агентів серед захищених амінокислот на основі раціонального дизайну: структурна подібність до меглітінідів, молекулярного докінгу та традиційного фармакологічного скринінгу.



На етапі дослідження синтезовано ряд циклічних імідів (2.1-2.8) шляхом взаємодії гексагідрофталевого ангідриду з амінокислотами у середовищі оцтової кислоти. Синтезовані N-захищені амінокислоти були утилізовані в реакції з карбонілімідазолом з утворенням проміжних імідазолідів, які не потребували виділення з реакційної суміші. Подальше додавання гідразино-хіназоліну та кип'ятіння у розчині діоксану на протязі двох годин призвело до утворення відповідних гідразидів (3.1-3.8). Синтезовані сполуки являють собою білі або жовті кристалічні речовини малорозчинні у воді, добре розчинні в органічних розчинниках. Індивідуальність синтезованих сполук підтверджена хроматомас-спектрометрично, будова - елементним аналізом, ІЧ- та ^1H -ЯМР-спектрами. Результати скринінгу на гіпоглікемічну активність дозволили виявити серед синтезованих амідів та гідразидів ряд сполук, які знижують рівень глюкози на протязі експерименту на 23,3-34,8% у дозі 25,0 та 50,0 мг/кг. Для встановлення перспективних напрямків подальшої модифікації був проведений аналіз результатів фармакологічного скринінгу та молекулярного докінгу, який дозволив виявити основні типи взаємодії серед найактивніших сполук, мітігліліду та діаформіну з амінокислотними залишками активних центрів білків HSD11B1, γ -PPAR та DPP4. Показано, що ряд сполук має більшу кількість центрів зв'язування (ARG288, CYS285, ARG288) ніж мітіглілід (SER342). Тобто, прослідковується висока спорідненість деяких синтезованих сполук до активного центру білку і, вірогідно, їх більш висока фармакологічна активність. Подальші дослідження в даному напрямку тривають.

ЦІЛЕСПРЯМОВАНИЙ ПОШУК ХІМОТЕРАПЕВТИЧНИХ ЗАСОБІВ СЕРЕД 5-N-ПОХІДНИХ БЕНЗО[4,5]ІМІДАЗО[1,2-C]ХІНАЗОЛІН-6(5H)-ОНУ

Кравцов Д. В., Воскобойнік О. Ю., Коваленко С. І.
 Запорізький державний медичний університет

Вступ. ДНК інтеркалятори використовуються під час хімотерапії як засоби, що інгібують реплікацію ДНК, в свою чергу це призводить до пригнічення мітотичного поділу клітини. Відомо, що молекула бензімідазолхіназоліну може інтеркалювати між ланцюгами ДНК, порушуючи просторову структуру матриці, подібно доксорубіцину. **Мета.** На сьогоднішній день відома лише невелика група похідних бензімідазолхіназоліну, а саме сполуки, які містять третинний амінний фрагмент, пов'язаний з тетрациклічною системою алкільною лінкерною групою, тому постало питання про формування нової групи 5-N-похідних бензо[4,5]імідазо[1,2-с]хіназолін-6(5H)-ону.

| | |
|---|-----|
| Гоцуля А. С., Федотов С. О. СИНТЕЗ ТА ВЛАСТИВОСТІ ДЕЯКИХ ПОХІДНИХ 1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОЛУ | 149 |
| Grygoriv G. V., Lega D. O., Chernykh V. P., Shemchuk L. A. SYNTHESIS AND ANTIMICROBIAL PROPERTIES OF 2-AMINO-4-ALKYL-4,6-DIHYDROPYRANO[3,2- C][2,1]BENZOXATHIIN-3-CARBONITRILE 5,5-DIOXIDES | 149 |
| Данильченко А. О., Німенко Г. Р. ВПЛИВ ДОПОМІЖНИХ РЕЧОВИН НА ОДНОРІДНІСТЬ ДОЗУВАННЯ ТА СТІЙКІСТЬ ТАБЛЕТОК ДО РОЗДАВЛЮВАННЯ ОТРИМАНИХ МЕТОДОМ ВОЛОГОЇ ГРАНУЛЯЦІЇ ДО СКЛАДУ ЯКИХ ВХОДИТЬ КАРБАМАЗЕПІН З ТІОТРИАЗОЛІНОМ | 149 |
| Доброва А. О., Головченко О. С., Георгіянец В. А. ПЕРСПЕКТИВИ МЕТОДИКИ УЛЬТРА-ВИСОКОЕФЕКТИВНОЇ РІДИННОЇ ХРОМАТОГРАФІЇ ДЛЯ КІЛЬКІСНОГО ВИЗНАЧЕННЯ ТАБЛЕТОК АМОКСИЦИЛІНУ КЛАВУЛАНАТУ | 150 |
| Долгих О. П., Шепель К. С., Романенко Г. М. СИНТЕЗ, РЕАКЦІЇ ТА БІОЛОГІЧНА ДІЯ ПОХІДНИХ 7-ЕТИЛКСАНТИНУ | 150 |
| Донченко А. О., Васюк С. О. ПОХІДНІ ХІНОНУ ЯК ПЕРСПЕКТИВНІ ОРГАНІЧНІ КОЛЬОРОРЕАГЕНТИ..... | 150 |
| Дроздова А. О., Давтян Л. Л. ОБҐРУНТУВАННЯ НАУКОВО-МЕТОДОЛОГІЧНИХ ПІДХОДІВ РОЗРОБКИ ПІННИХ ЛІКУВАЛЬНО-КОСМЕТИЧНИХ ЗАСОБІВ | 150 |
| Дуюн І. Ф., Мазулін О. В., Мазулін Г. В. НАКОПИЧЕННЯ ВІТАМІНУ К ₁ У ТРАВІ ACHILLEA COLLINA J. BECKER. EX REICHENH | 151 |
| Жук Ю. М., Васюк С. О., Сидоренко Н. О. СПЕКТРОФОТОМЕТРИЧНЕ ВИЗНАЧЕННЯ КАРВЕДІЛОЛУ В ЛІКАРСЬКИХ ФОРМАХ | 151 |
| Заїка Є. О., Воскобойнік О. Ю., Коваленко С. І. СПРЯМОВАНИЙ ПОШУК СПОЛУК З АНТИМІКРОБНОЮ АКТИВНІСТЮ СЕРЕД ПОХІДНИХ ТРИАЗОЛУ, ХІНАЗОЛІНУ ТА ТРИАЗОЛОХІНАЗОЛІНУ З ПІРАЗОЛЬНИМ ФРАГМЕНТОМ | 151 |
| Зеленюк А. Ю., Донченко А. О., Васюк С. О. СПЕКТРОФОТОМЕТРИЧНЕ ВИЗНАЧЕННЯ МЕТОПРОЛОЛУ ТАРТРАТУ | 152 |
| Ігнатова Т. В., Каплаушенко А. Г., Фролова Ю. С. ПРОГНОЗУВАННЯ БІОЛОГІЧНОЇ ДІЇ СПОЛУК ПОХІДНИХ 4-R-5-ФЕНЕТИЛ-2,4-ДИГІДРО-3Н-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОНІВ | 152 |
| Кисличенко О. А., Процька В. В., Журавель І. О. ВИЗНАЧЕННЯ КІЛЬКІСНОГО ВМІСТУ ВІЛЬНИХ КАРБОНОВИХ КИСЛОТ В СЛАНЯХ ПАРМЕЛІЇ БОРОЗДЧАТОЇ ТА ПАРМЕЛІЇ ПЕРЛИНОВОЇ | 152 |
| Kinichenko A. O., Trzhetsynskiy S. D. QUANTITATIVE DETERMINATION OF HYDROXYCINNAMIC ACIDS OF PORTULACA OLERACEA HERB | 153 |
| Кіпоть Я. Ю., Бідненко О. С. ЩОДО СТАНДАРТИЗАЦІЇ СУБСТАНЦІЇ БРОМІД 1-В-ФЕНІЛЕТІЛ-4-(N-ДИМЕТИЛАМІНОБЕНЗИЛДЕНАМІНО)-1,2,4- ТРИАЗОЛІО | 153 |
| Коваленко С. І., Антипенко О. М. СТРАТЕГІЯ ПОШУКУ ПРОТИЗАПАЛЬНИХ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ НА ОСНОВІ ТЕТРАЗОЛО[1,5-С]ХІНАЗОЛІНУ ... | 153 |
| Коваленко С. І., Гудзь О. О., Ставицький В. В. ЦІЛЕСПРЯМОВАНИЙ ПОШУК ПРОТИЗАПАЛЬНИХ АГЕНТІВ СЕРЕД ПОХІДНИХ ПРОДУКТІВ РЕАКЦІЙ 2-АМІНО-N- R-БЕНЗАМІДІВ З γ КЕТОКАРБОНОВИМИ КИСЛОТАМИ | 154 |
| Коваленко С. І., Казунін М. С., Селіванова Є. А., Мартиненко Ю. В. N-ЗАХИЩЕНІ АМІНОКИСЛОТИ З ІЗОІНДОЛІНОВИМ ТА ХІНАЗОЛІНОВИМ ФРАГМЕНТАМИ ЯК НОСІЇ ГІПОГЛІКЕМІЧНОЇ ДІЇ | 155 |
| Кравцов Д. В., Воскобойнік О. Ю., Коваленко С. І. ЦІЛЕСПРЯМОВАНИЙ ПОШУК ХІМІОТЕРАПЕВТИЧНИХ ЗАСОБІВ СЕРЕД 5-N-ПОХІДНИХ БЕНЗО[4,5] ІМІДАЗО[1,2-с]ХІНАЗОЛІН-6(5Н)-ОНУ | 155 |
| Кравченко Т. В. ВИВЧЕННЯ ДІУРЕТИЧНОЇ АКТИВНОСТІ ПОХІДНИХ 4-АМІНО-5-МЕТИЛ-4Н-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОНУ | 156 |
| Кременська Л. В., Родінкова В. В., Мотрук І. І., Паламарчук О. О., Кременський О. О. ЧАСОВІ ТА КІЛЬКІСНІ ХАРАКТЕРИСТИКИ ПИЛКУВАННЯ РОСЛИН РОДИНИ АМАРАНТОВИХ У ВІННИЦІ ПРОТЯГОМ 2013-2017 р.р..... | 156 |
| Кустова С. П., Бойко М. О., Матвеева Т. В., Карпенко Н. О., Коренева Є. М., Белкіна І. О., Клочков В. К. ВИЗНАЧЕННЯ КОНСЕРВУЮЧОГО АГЕНТУ РІДКОЇ ПЕРОРАЛЬНОЇ ЛІКАРСЬКОЇ ФОРМИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЕНДОКРИНОПАТІЙ | 157 |
| Кухтенко Г. П., Гладух Е. В., Швець Д. В., Кухтенко О. С. ЕКСПЕРИМЕНТАЛЬНІ ДОСЛІДЖЕННЯ ПРИ РОЗРОБЦІ СУПОЗИТОРІЇВ ДЛЯ ЗАСТОСУВАННЯ У КОЛОПРОКТОЛОГІЇ..... | 158 |