

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ



Серія «Наука»

АКТУАЛЬНІ ПИТАННЯ СТВОРЕННЯ НОВИХ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

МАТЕРІАЛИ ВСЕУКРАЇНСЬКОЇ
НАУКОВО-ПРАКТИЧНОЇ КОНФЕРЕНЦІЇ
СТУДЕНТІВ ТА МОЛОДИХ ВЧЕНИХ

19-20 квітня 2012 року
м. Харків

У двох томах

Том I

Харків
НФаУ
2012

СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ 4-(ФУРАН-2-ІЛ-МЕТИЛАМІНО)-1-R-4H-1,2,4-ТРИАЗОЛІЙ ГАЛОГЕНІДІВ

Британова Т.С., Кучерявий Ю.М., Панасенко О.І., Книш Є.Г.

Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя

goculyats@mail.ru

В сучасних умовах медицина потребує нових більш ефективних лікарських засобів. Значний інтерес представляє клас гетероциклічних сполук, що містять гетероатом Нітроген.

Пошук біологічно активних речовин серед похідних N-(фуран-2-ілметил)-4-аміно-1,2,4-тріазолу є перспективним напрямком у сфері створення нових лікарських засобів. Саме завдяки низькій токсичності та різноманітним видам біологічної активності похідні N-(фуран-2-ілметил)-4-аміно-1,2,4-тріазолу привертають значну увагу науковців.

Метою даної роботи був цілеспрямований синтез похідних 4-(фуран-2-ілметиламіно)-1-R-4H-1,2,4-тріазолію галогенідів та дослідження їх біологічної дії.

Для досягнення поставленої мети вирішувалися наступні завдання: розробити найбільш ефективний спосіб синтезу зазначених сполук, вивчити їх фізико-хімічні характеристики та дослідити можливу біологічну активність.

Синтез відповідних сполук здійснено наступним чином: в якості вихідної речовини використовували 4-(фуран-2-ілметил)-4-аміно-1,2,4-тріазол, що вступає в реакцію з еквімолекулярною кількістю α -галогенкетону (2-бром-1-(4-метоксифеніл)етанону, 1-(біфеніл-4-іл)-2-брометанону, 2-бром-1-фенілетанону, 4-нітро-2-бром-1-фенілетанону, 2-хлор-1,2-біфеніл-етанону) або кислотою монохлорацетатною в середовищі етанолу, метанолу або ізопропанолу шляхом нагрівання протягом 5-6 год. Таким чином були отримані відповідні 4-(фуран-2-ілметиламіно)-1-(1-R₁-2-R₂-2-оксоетил)-4H-1,2,4-тріазолію галогеніди та 1-(карбоксиметил)-4-(фуран-2-ілметиламіно)-4H-1,2,4-тріазолію хлорид.

Структуру синтезованих сполук встановлено фізико-хімічними методами та підтверджено даними елементного аналізу.

З метою визначення фармакологічного потенціалу синтезованих сполук проведено віртуальний скринінг за допомогою програми PASS. Серед отриманих структур виявлені сполуки з антимікробною, протівірусною та діуретичною активністю. Встановлені деякі закономірності зв'язку «будова-дія», які можуть бути застосовані для цілеспрямованого пошуку біологічно активних речовин серед похідних 4-аміно-1,2,4-тріазолу.