

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ
КАФЕДРА ФАРМАКОТЕРАПІЇ**

ЛІКИ – ЛЮДИНІ

**Сучасні проблеми створення,
вивчення та апробації
лікарських засобів**

Матеріали XXVIII всеукраїнської
науково-практичної
конференції з міжнародною участю

**3 лютого 2011 року
м. Харків**

*Реєстраційне посвідчення УкрІНТЕІ
№ 1 від 10 січня 2011 року*

Харків
Видавництво НФаУ
2011

химический раздражитель на 45,9% ($p < 0,05$) и по активности превосходит диклофенак натрия.

Замена в этих соединениях метильных радикалов на оксиметильные (соед. 5,6) снижает их активность до 6%. Введение во 2-е- и 4-е положение фенильного кольца нитрогрупп (соед. 7,8), брома (соед. 9), сульфмоила (соед. 10) немного уменьшает противовоспалительное действие. Замена в этих соединениях метильных радикалов на оксиметильные (соед. 5,6) снижает их активность до 6%.

Введение во 2-е- и 4-е положение фенильного кольца нитрогрупп (соед. 7,8), брома (соед. 9), сульфмоила (соед. 10) немного уменьшает противовоспалительное действие.

Установлено, из всех изученных веществ наибольшей антиноцицептивной активностью обладает соединение 32, которое можно рекомендовать для изучения специфической активности.

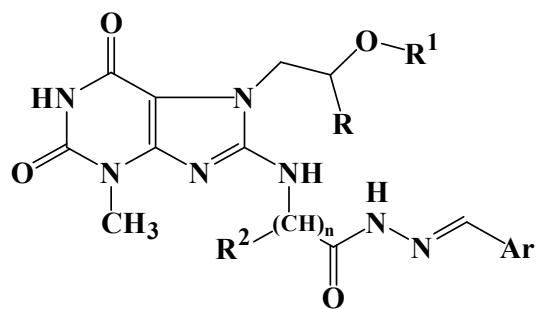
Таким образом, синтетические производные N-фенилантранило-вой и бензойной кислот являются перспективной группой органических соединений для дальнейшего целенаправленного проведения синтеза и фармакологического скрининга с целью создания на их основе фармакологических веществ с противовоспалительными свойствами.

СИНТЕЗ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ БЕНЗИЛІДЕНГІДРАЗИДІВ 7-ЗАМІЩЕНИХ 3-МЕТИЛКСАН- ТИНІЛ-8-АМІНОАЛКАНОВИХ КИСЛОТ

Мартинюк О.О., Романенко М.І., Черчесова О.Ю.,
Шарапова Т.М., Макоїд О.Б., Біленький С.А.
Запорізький державний медичний університет, Запоріжжя

Як відомо ряд амінокислот та їх похідних входять до складу багатьох лікарських препаратів (гліцин, цистеїн, метіонін, аміналон, АЦЦ, пірацетам, ангіотензамід та ін.). Молекула ксантину лежить в основі таких ефективних лікарських засобів як кофеїн, теофілін, теобромін, трентал та інші. Отже введення амінокислотних залишків в молекулу ксантину може спричинити як різке посилення відомих фармакологічних ефектів, так і появу нових, а також, на наш погляд, може знизити токсичність похідних ксантину.

З метою пошуку нових біологічно активних сполук нами був синтезований ряд невідомих раніше похідних 3-метилксантиніл-8-аміноалканових кислот, наведеної нижче загальної формули, вивчені їх структурні особливості та антиоксидантна дія.



$R = H, \text{ alk, Aryl, alkoxymethyl, Aryloxymethyl};$

$R^1 = H, CH_3, C_6H_5; R^2 = H, CH_3, CH_2C_6H_5; n = 1-5$

Вихідні 8-бромо-7- β -гідроксietилксантини отримані алкілуванням 8-бромо-3-метилксантину відповідними β -галогенспиртами, галогенетерами або заміщеними оксирану. Взаємодією отриманих 7-заміщених 8-бромоксантину з амінокислотами був синтезований ряд ксантиніл-8-аміноалканових кислот, естерифікацією яких одержані відповідні естери. Реакція естерів з надлишком гідразину гідрату веде до утворення їх гідразидів, які легко вступають в реакцію конденсації з ароматичними альдегідами з утворенням бензиліденгідразидів 3-метилксантиніл-8-аміноалканових кислот.

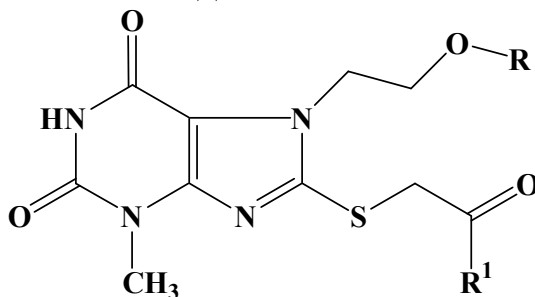
Вивчення біологічної дії більшості отриманих похідних 3-метилксантиніл-8-аміноалканових кислот показало їх високу антиоксидантну та антигіпоксичну дії.

СИНТЕТИЧНІ ДОСЛІДЖЕННЯ ПО ПОШУКУ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН СЕРЕД 7- β -ГІДРОКСІЕТИЛЗАМІЩЕНИХ КСАНТИНІЛ-8-ТІОАЦЕТАТНОЇ КИСЛОТИ

Мартинюк О. О., Романенко М. І., Черчесова О. Ю.,
Шарапова Т. М., Рудько Н. П., Самко А. В.

Запорізький державний медичний університет, м.Запоріжжя

У зв'язку з високою та різнобічною біологічною дією 7,8-дизаміщених ксантину нами був синтезований ряд нових похідних 7- β -гідроксі-етил-3-метил-ксантиніл-8-ацетатної кислоти наведеної нижче структури та вивчена їх анитиоксидантна та антигіпоксична активність.



$R = H, CH_3, C_6H_5$

$R^1 = OH, O\text{-alkyl}, NH_2, NH\text{-alkyl}, NH\text{-NH}_2, \text{---}N\text{---}X (X=O, NH, CH_2)$