

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

ЛІКИ – ЛЮДИНІ

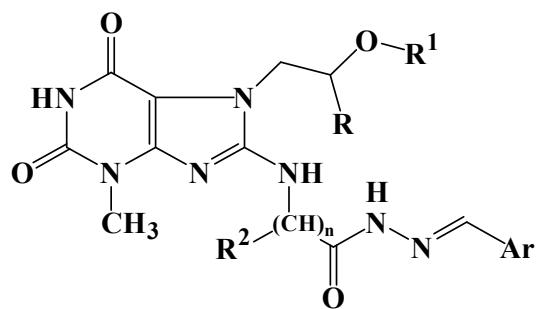
**Сучасні проблеми створення,
вивчення та апробації
лікарських засобів**

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



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

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

Вихідні 8-бромо-7- β -гідроксietилксантини отримані алкілуванням 8-бромо-3-метилксантину відповідними β -галогенспиртами, галогенетерами або заміщеними оксирану. Взаємодією отриманих 7-заміщених 8-бромок-сантину 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.

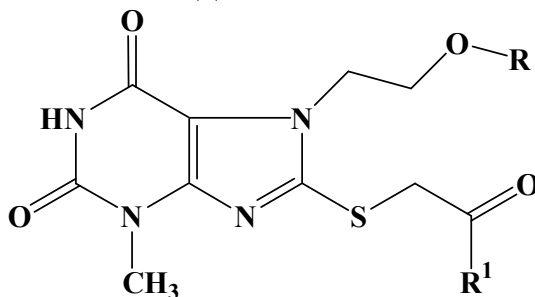
Вивчення біологічної дії більшості отриманих похідних 3-метилксантиніл-8-аміноалканових кислот показало їх високу антиоксидантну та антигіпоксичну дії.

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.



$R = H, CH_3, C_6H_5$

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

Вихідні 8-бромо-7- β -гідроксіетилксантини були синтезовані взаємодією 8-бромо-3-метилксантину з етиленхлоргідрином, або з відповідними хлоретилловими етерами в диметилформаміді. Подальше заміщення атому бром у положенні 8 ксантинової молекули на залишок тіогліколевої кислоти веде до утворення 7-R-ксантиніл-8-тіоацетатних кислот, на основі яких були отримані відповідні алкілові естери, нагріванням яких з первинними та вторинними амінами чи гідразину гідратом синтезовані амід та гідразиди ксантинیل-8-тіоацетатних кислот. Взаємодією вказаних вище кислот з первинними та вторинними амінами були одержані водорозчинні солі.

Будова синтезованих речовин доведена за допомогою елементного аналізу, ІЧ- та ПМР-спектроскопії, мас-спектрометрії. Індивідуальність сполук підтверджена методом тонкошарової хроматографії.

Фармакологічні дослідження показали наявність у більшості синтезованих похідних 7- β -гідроксіетил-3-метил-ксантиніл-8-ацетатної кислоти виразної антиоксидантної та антигіпоксичної активностей. Обговорюються деякі закономірності у ряді «будова-дія».

ДОСЛІДЖЕННЯ АНТИОКИСЛЮВАЛЬНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ НОВИХ ПОТЕНЦІЙНИХ АНТИГІПОКСАНТІВ ПРИ ЕКСПЕРИМЕНТАЛЬНІЙ ГІПОКСІЇ

Марущак М.І., Яворська С.І.

Тернопільський державний медичний університет імені
І.Я. Горбачевського, м. Тернопіль

Вчені довели, що в патогенезі найбільш поширених захворювань людини є чітко виражена вільно-радикальна фаза. Вплив патологічних чинників супроводжується зростанням окиснювального метаболізму, збільшенням продукції активних форм кисню та активацією процесу перекисного окиснення ліпідів.

У зв'язку з необхідністю корекції даних процесів постійно проводиться пошук нових антиоксидантів та антигіпоксантив. Для цього, на етапі скринінгу на моделі гіпоксії замкненого простору в щурів для поглибленого вивчення відібрано нові похідні теофіліну ТД-22, КД-235 (синтезовані доцентом кафедри фармацевтичної хімії нашого університету Д.Б. Коробком), які проявили виражену антигіпоксичну дію.

Зважаючи на те, що на рівень резистентності тварин до гіпоксії може суттєво вплинути і їх антиокиснювальна властивість, було проведено дослідження даного параметру в умовах *in vitro*.

Антиокиснювальну активність плазми крові визначали