МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ



Серія «Наука»

ЛІКИ – ЛЮДИНІ.

СУЧАСНІ ПРОБЛЕМИ ФАРМАКОТЕРАПІЇ І ПРИЗНАЧЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

Матеріали XXX Всеукраїнської
науково-практичної конференції
з міжнародною участю

23 травня 2013 року
м. Харків

Реєстраційне посвідчення УкрІНТЕІ
№ 580 від 24 вересня 2012 року

Харків
НФаУ
2013

СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ ПОХІДНИХ 1-(3-ТІО-1,2,4-ТРІАЗОЛІЛ-5)-МЕТИЛТЕОБРОМІНУ

Романенко М.І., Іванченко Д.Г., Самура Б.А.,
Корнієнко В.І., Кривуша О.О., Таран А.В., Макоїд О.Б.
Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя
Національний фармацевтичний університет, м. Харків

Відомо, що як природні так і синтетичні похідні ксантину виявляють широкий спектр біологічної дії, мають низьку токсичність і давно використовуються в практичній медицині в якості лікарських препаратів. Високу та різнобічну фармакологічну дію виявляють також похідні 1,2,4-тріазолу.

Метою даної роботи є розробка способів отримання неописаних в літературі похідних ксантину, які б містили в своїй структурі функціональнозаміщене ядро 1,2,4-тріазол, та вивчення їх біологічної дії. Вказані сполуки були отримані взаємодією теоброміну та його 8-аміно(бромо)заміщених з естерами хлороцтової кислоти, які після обробки гідразину гідратом дають відповідні гідразиди теобромініл-1-оцтової кислоти. Останні легко приєднують алкіл(арил)ізотіоцианати, утворюючи відповідні похідні тіосемикарбазиду, наступною циклізацією яких у лужному середовищі був синтезований ряд 1-(3-тіо-1,2,4-тріазоліл-5)-метилтеобромінів, алкілуванням яких у водно-спиртовому розчині лугу були одержані відповідні заміщені по атому сульфуру.

Чистота та індивідуальність синтезованих речовин контролювалась методами ІЧ-, ПМР-спектроскопії, мас-, хроматомас-спектрометрії, ТШХ.

Для доведення доцільності проведення фармакологічного скринінгу *in vivo* були використані методи дослідження *in silico*. Було встановлено, що всі одержані сполуки відповідають вимогам «правил п’яти» Ліпінські. Надалі за допомогою програми PASS були розраховані ймовірні ефекти біологічної дії (діуретична, аналгетична, протизапальна).

Дослідження показали, що більшість речовин виявляють виражену антигіпоксичну, антиоксидантну, діуретичну, аналгетичну та протизапальну дії, причому деякі з них за показниками зазначеного ефекту перевищують еталони порівняння – мексідол, аскорбінова кислота, фуросемід, гіпотіазид, анальгін та диклофенак. Встановлена залежність фармакологічної дії від структури синтезованих сполук.

Посохова Я., Омарова Р.А., Грудько В.А. Выделение и качественная оценка эфирного масла из еловых иголок 94

Райкова Т.С., Білай І.М., Рижов О.А., Мозуль В.І., Масюта Ю.А. Основні напрямки фітотерапії атеросклерозу 96

Рак Т.М., Романенко М.І., Макоїд О.Б., Самура Б.А., Корнієнко В.І., Кривуша О.А., Таран А.В. Синтез, фізико-хімічні та біологічні властивості солей 7-ацетилалкіл-8-N-піперазиноксантинів 98

Рибалкін М.В., Стрілець О.П., Стрельников Л. С. Дослідження впливу величини водневого показника на активність розчину алергену гриба *Candida albicans* 99

Романенко М.І., Іванченко Д.Г., Самура Б.А., Корнієнко В.І., Кривуша О.О., Таран А.В., Макоїд О.Б. Синтез та біологічні властивості похідних 1-(3-тіо-1,2,4-тріазоліл-5)-метилтеоброміну 100

Романенко М.І., Милова А.О., Іванченко Д.Г., Бородіна Н.І., Шарапова Т.А., Стрибайло С.В. Синтез, фізико-хімічні та антиоксидантні властивості 8-іліденгідразинопохідних 7-(піридинил-4-)метилксантинів 101

Романенко М.І., Полевик І.В., Рак Т.Н., Черчесова О.Ю., Бородіна Н.І., Шарапова Т.М. Пошук антигіпоксичних сполук серед похідних імідазо[1,2-f]ксантиніл-8-алканових кислот 102

Романенко М.І., Черчесова О.Ю., Білай І.М., Остапенко А.О., Полевик І.В., Бородіна Н.І. Синтез та антиагрегантна активність 8-амінозаміщених 7-β-гідрокси-γ-*і*-пропоксипропілксантину 103

Сердюк О.І., Мінак В.О., Просоленко Н.В., Піонтковська О.В. Технологія управління медичної організації в системі менеджменту 104

Стефанів І.В., Гращенкова С.А. Дослідження динаміки розвитку експериментального гінгівіту у щурів 105

Стороженко Е.В., Звягинцева Т.В., Наумова О.В. Влияние сиропа амксесол на морфогенез легочной ткани при экспериментальном бронхоальвеолите 106

Тимчишин О. Л., Кресюн В. Й., Годован В. В. Оцінка впливу медгерму на вміст продуктів перекисного окислення ліпідів у тварин з експериментальним токсичним гепатитом 108

Труш Г.С. УФ-спектрофотометричне дослідження оланзапіну в судово-хімічному аналізі 109

Харченко О.М., Кононенко Н.Н. Перспективы использования антиоксиданта кверцетина при сахарном диабете 110