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

# АКТУАЛЬНІ ПИТАННЯ СТВОРЕННЯ НОВИХ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

МАТЕРІАЛИ ВСЕУКРАЇНСЬКОЇ

НАУКОВО - ПРАКТИЧНОЇ КОНФЕРЕНЦІЇ

СТУДЕНТІВ ТА МОЛОДИХ ВЧЕНИХ,

*присвячена пам'яті*

*доктора фармацевтичних та хімічних наук, професора*

***МИКОЛИ ОВКСЕНТІЙОВИЧА ВАЛЯШКО***

(до 140-річчя від дня народження)

**21-22 квітня 2011 року**

**м. Харків**

**Харків**
**Видавництво НФаУ**
**2011**

## СИНТЕЗ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ S-ПОХІДНИХ 5-R-4-$R_1$-1,2,4-ТРІАЗОЛ-3-ТІОНУ

Парченко В.В. доц., Каплаушенко А.Г. доц., Куліш С.М. ас., Гоцуля А.С. ас.,
Щербина Р.О. ас., Пругло Є.С. ас., Сафонов А.А., Кучерявий Ю.М.
Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя

Завдяки наявності ряду цінних властивостей похідні 1,2,4-тріазолу викликають беззаперечний інтерес у науковців багатьох країн. Зацікавленість до поглибленого вивчення хімічних, фізико-хімічних та біологічних властивостей 3-тіо-1,2,4-тріазолів та їх похідних постійно зростає у зв'язку з тим, що похідні даної гетероциклічної системи доступні для синтезу, реакційноздатні та досить перспективні для синтезу біологічно активних речовин. Особливу увагу дослідників привертають фармакологічні властивості даного ряду сполук. На сьогоднішній день в медичній практиці з успіхом використовуються такі препарати як флуконазол, ітраконазол, вориконазол, альпразолам, тіотріазолін, які набули популярності серед лікарів завдяки своїй різнобічній біологічній дії. Метою нашої роботи був синтез нових S-похідних на основі 5-R-4-$R_1$-1,2,4-тріазол-3-тіону, де R = метил, феніл, 4-нітрофеніл, фуран-2-іл, піридин-2-іл, піридин-3-іл, піридин-4-іл, $R_1$ = етил, феніл, 2-толіл, 2-метоксифеніл, 4-бромфеніл, 4-нітрофеніл, 4-хлорбензиламіно. Для досягнення поставленої мети нами були вивчені спектральні характеристики відповідних вихідних тіонів для констатації тіон-тіольної таутомерії і обґрунтування направленості реакцій взаємодії цих сполук з галогеналканами, галогенарилами, α-галогенкарбоновими кислотами, галогенальдегідами та галоген-гетероциклами. Встановлено, що у лужному розчині тіон-тіольна рівновага зміщується в сторону тіольної форми та відбувається часткове закріплення даного виду таутомерії. У кислому та нейтральному середовищі вихідні сполуки існують у формі тіону. Реакції проводились у спиртовому середовищі в присутності еквімолекулярної кількості натрій гідроксиду. Реакційну суміш нагрівали до нейтрального середовища, фільтрували, розчинник випаровували. Структура синтезованих сполук була встановлена за допомогою ІЧ-, УФ -, $^1$Н ЯМР-спектроскопії, елементного аналізу, хроматомас- та мас-спектрометрії, а в деяких випадках рентгеноструктурним аналізом. Тонкошаровою хроматографією була підтверджена їх індивідуальність. Досліджено гостру токсичність синтезованих сполук та їх антиоксидантну, протигрибкову, гіполіпідемічну, антимікробну, нейролептичну та протизапальну активність. Серед цих сполук виявлено ряд «структур-лідерів». Проведені фармакологічні дослідження синтезованих сполук показали, що отримані речовини відносяться до класу помірно токсичних або малотоксичних речовин. Результати, які були отримані в процесі біологічних досліджень виділених сполук, дозволяють стверджувати, що похідні 5-R-4-$R_1$-1,2,4-тріазол-3-тіону проявляють високу біологічну активність. Серед синтезованих знайдені сполуки, які володіють вираженою протизапальною, антимікробною, протигрибковою, діуретичною, нейролептичною та антиоксидантною активністю. Проведений фармакологічний скринінг визначив деякі закономірності взаємозв'язку між хімічною будовою та біологічною дією нових біологічно активних речовин в досліджуваній області. Сформульовано ряд висновків для подальшого синтезу сполук з відповідною активністю.

# ЗМІСТ


**СЕКЦІЯ 1 СИНТЕЗ ФІЗІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН ..... 3**

Iurchenko I.O., Buryak V.P. ..... 4
Андронова А.І., доц. Губін Ю.І., Заремба О.В., Ніколаєнко П.В. ..... 5
Бевз О.В. асп., С.І. Янкович асп., проф. Українець І.В., проф. Савченкова Л.В. ..... 6
Булига Л.О., доц. Єрьоміна З.Г., проф. Ісаєв С.Г. ..... 7
Булига Л.О., Єрьоміна Г.О., проф. Ісаєв С.Г. ..... 8
Булига Л.О., доц. Єрьоміна З.Г., проф. Ісаєв С.Г. ..... 9
Гоцуля Т.С. ас., Миколасюк О.О. ..... 10
Григорів Г.В. ст. 3к., 15 гр., доц. Ситнік К.М., проф. Шемчук Л.А. ..... 11
Демченко С.А., Бобкова Л.С., акад. Лозинський М.О. ..... 12
Казунин М.С., Прийменко А.О., Васильев Д.А. ..... 13
Касімова М.В. ..... 14
Колядич О.П., Голембіовська О.І., Бобкова Л.С. ..... 15
Корницька Т.О., Булига Л.О., проф. Ісаєв С.Г. ..... 16
Кроленко К.Ю., доц. Власов С.В., проф. Коваленко С.М., проф. Черних В.П. ..... 17
Левченко В.А., маг. Сірий Д.Ю., с.н.с. Сілін О.В., проф. Коваленко С.М. ..... 18
Лега Д.О., асп. Левашов Д.В., проф. Шемчук Л.А. ..... 19
Мамедова Д.О. асп. , проф. Гриценко І.С., проф. Ісаєв С.Г ..... 20
Матяш О., Педан Г. , доц. Перехода Л. О, доц. Сич І.А ..... 21
Палагнюк М.М., доц. Коробко Д.Б., Пилипів Є.С., Колесник О.О. ..... 22
Парченко В.В. доц., Каплаушенко А.Г. доц., Куліш С.М. ас., Гоцуля А.С. ас.,
Щербина Р.О. ас., Пругло Є.С. ас., Сафонов А.А., Кучерявий Ю.М. ..... 23
Прийменко А.О., Васильев Д.А., Казунин М.С. ..... 24
Сафонов А.А., ас. Щербина Р.О., доц. Парченко В.В., доц. Каплаушенко А.Г. ..... 25
Северіна Г.І., Скупа О.О., Георгіянц В.А. ..... 26
Сентяй В.О., проф. Ісаєв С.Г. ..... 27
Скороход О. А., ас. Бризицький О. А. ..... 28
Сулейман М.М., Капустник Р.О., доц. Ісаєв С.Г., проф. Свєчнікова О.М. ..... 29
Хайрулин А.Р., Демченко А.М., Лозинский М.О. ..... 30
Хрущова О.В, доц. Кобзар Н.П., проф. Ісаєв С.Г. ..... 31
Шемчук О.Л. маг., проф. Українець І.В. ..... 32

**СЕКЦІЯ 2 ДОСЛІДЖЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ РОСЛИН ТА СТВОРЕННЯ ФІТОПРЕПАРАТІВ ..... 33**

Barsuk D.O., Kolesnik Ya.S., Ermolenko O.A., as. Stremouhov A.A., prof. Kovalyov V.N. ..... 34
Berezentsieva I.A., Barsuk D.O., as. Stremouhov A.A., prof. Kovalyov V.N. ..... 35
Beztsennaya T.S., ass. prof. Shulga L.I., Voida J.V. ..... 36
Абдулкафарова Е.Р., проф. Ковальова А.М., ас.Сидора Н.В. ..... 36
Абдулкафарова Е.Р., проф. Ковальова А.М., ас. Сидора Н.В. ..... 37
Алєксєєнко А.П., ас. Ткаченко М.Ф. ..... 38
Барна О.М., доц. Соколова Л.В. ..... 39
Безноско Д.М., доц. Краснікова Т.О. ..... 40
Бердей Т.С. ..... 41
Брихунченко О.А., Горячая О.В., доц. Ильина Т.В., проф. Ковалева А.М. ..... 42
Бурда Н.Є., доц. Журавель І.О. ..... 43
Бурцева О.В., доц. Тернинко І.І. ..... 44
Владимиров О.Ю., доц. Гарна С.В. ..... 45
Владимирова І.М. доц. ..... 46
Войтенко Я., Бурлака І.С., проф. Кисличенко В.С. ..... 47
Волкова Н., Гляпа К.Л., ас. Рудник А.М., доц. Бородіна Н.В. ..... 48