

ПОШУК БАР ШИРОКОГО СПЕКТРУ ДІЇ СЕРЕД ЗАМІЩЕНИХ КСАНТИНУ

Шкода О.С., Прийменко Б.О., Романенко М.І., Александрова К.В.,

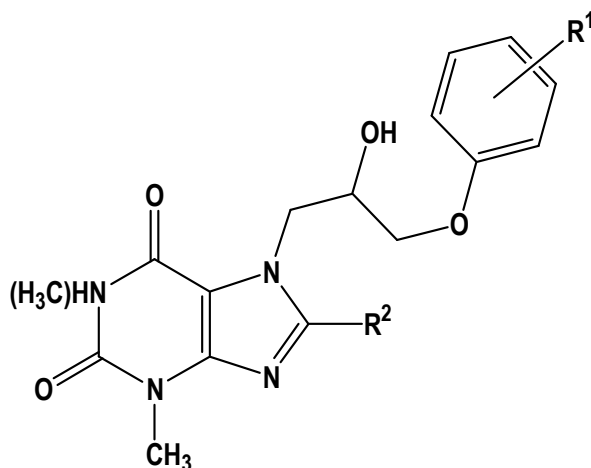
Шарапова Т.А., Черчесова О.Ю.

Запорізький державний медичний університет

Створення доступних за ціною та високоефективних оригінальних лікарських засобів широкого спектру дії – одна з пріоритетних задач вітчизняної фармацевтичної галузі. Найбільш перспективним напрямом цього пошуку є модифікація структури нетоксичних біологічно активних сполук рослинного чи тваринного походження.

Похідні ксантинів, як речовини з мультифакторіальним фармакодинамічним ефектом, займають особливе становище, оскільки на основі природних ксантинів (кофеїн, теофілін і теобромін) створено декілька десятків синтетичних похідних, які успішно використовуються в медичній практиці для лікування різноманітних захворювань (трентал, дипрофілін, ксантинолу нікотинат, етофілін та інш.). Тому пошук біологічно активних сполук серед похідних ксантину є актуальним та перспективним.

Враховуючи вищезазначене нами розроблено прості методи синтезу чисельного ряду не описаних раніше похідних 3-метилксантину та теофіліну загальної формули:



$R^1 = H, CH_3$ (*o*-, *m*-, *p*-), Cl (*n*-); $R = H, Hal$, залишок первинного чи вторинного аміну, $SH, S-Alk, S-Alkenyl, S-ArAlk, S-hydroxyalk, S-oxoalk, NH-NH_2$, іліденгідразино.

Структура одержаних сполук беззаперечно доведена за допомогою сучасних фізико-хімічних методів дослідження (ІЧ-, ПМР-спектроскопія, мас-спектрометрія). Чистота та індивідуальність синтезованих речовин перевірена за допомогою тонкошарової хроматографії.

Проведений первинний фармакологічний скрінінг показав, що синтезовані сполуки є мало- або помірнотоксичними, виявляють виражену діуретичну, анальгетичну, протизапальну, антиаритмічну та антиоксидантну активності, також були встановлені деякі закономірності між будовою сполук та їх біологічною дією.

Синтез та фармакологічна дія найбільш активних речовин захищена патентами України, ці сполуки рекомендовані для поглибленого вивчення.