

СИНТЕЗ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ S-ПОХІДНИХ 5-R-4-R₁-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОНУ

Щербина Р.О., Куліш С.М., Парченко В.В., Панасенко Т.В.,
Каплаушенко Т.М., Постол Н.А., Смірнова К.І., Книш Е.Г.
Запорізький державний медичний університет

Останнім часом, проблема створення нових високоефективних лікарських засобів досить гостро повстала перед фармацевтичною наукою.

Можливим шляхом вирішення цього питання є цілеспрямований синтез нових фармакологічно активних сполук, які в майбутньому можуть стати основою нових препаратів.

В цьому контексті значну увагу привертають гетероциклічні системи на основі S-похідних 1,2,4-триазолу, які вже встигли зарекомендувати себе як ефективні та малотоксичні лікарські засоби.

Метою нашої роботи був цілеспрямований синтез 5-R-4-R₁-1,2,4-триазол-3-тіонів та їх S-похідних, встановлення їх фізико-хімічних та біологічних властивостей.

Як вихідні речовини в синтезі ми використовували 5-R-4-R₁-1,2,4-триазол-3-тіони (де, R= H, метил, феніл, 3-, 4-нітрофеніл, фуран-2-іл, 2-піридил, 2-оксихіноліл; R₁= метил, етил, феніл, *o*-метоксифеніл, *n*-бромофеніл). для яких вивчали реакції алкілювання хлороацетатною кислотою та хлороацетальдегідом.

Для 2-(5-R-4-R₁-1,2,4-триазол-3-ілтіо)ацетатних кислот вивчалися реакції етерифікації спиртами (метиловим, етиловим, *n*-пропіловим, *i*-пропіловим, *n*-бутиловим, *i*-бутиловим, *n*-аміловим, *i*-аміловим) та утворення солей, з органічними (моноетаноламоній, діетиламоній, діетаноламоній, піперидин, морфолін) та неорганічними основами (натрію гідроксид, калію гідроксид, амоніак, магнію оксид, кальцію карбонат).

2-(5-R-4-R₁-1,2,4-Триазол-3-ілтіо)ацетальдегіди конденсували з гідразидами ароматичних (бензойної, 3-нітро та 4-нітробензойної, 2-гідроксибензойної, 5-бромо-2-гідроксибензойної) і гетероциклічних (3-піридинкарбонової, 4-піридинкарбонової, 2-метил-3-фуранкарбонової, 3-гідроксихінолін-4-карбонової) кислот.

Будова сполук підтверджена даними елементного аналізу, УФ-, ІЧ-, ПМР-спектроскопією, мас-спектрометрією, в деяких випадках зустрічним синтезом, а їх індивідуальність доведена методом тонкошарової хроматографії.

Для більшості синтезованих сполук вивчено гостру токсичність, діуретичну, протимікробну та гіполіпідемічну активності.

Встановлено, що більшість синтезованих нами сполук малотоксичні або практично нетоксичні речовини. Виявлені деякі закономірності між хімічною будовою та біологічною дією зазначених сполук.

Пошук біологічно активних речовин у даному ряді гетероциклічних систем продовжується.