

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

СИНТЕЗ І АНАЛІЗ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН І ЛІКАРСЬКИХ СУБСТАНЦІЙ

Тези доповідей Всеукраїнської науково-практичної
конференції з міжнародною участю, присвяченої
80-річчю з дня народження доктора фармацевтичних наук,
професора О. М. Гайдукевича

12-13 квітня 2018 року
м. Харків

Харків
НФаУ
2018

СИНТЕТИЧНІ ДОСЛІДЖЕННЯ З ПОШУКУ БІОАКТИВНИХ СПОЛУК СЕРЕД ПОХІДНИХ 8-ТІОТЕОБРОМІН-1-ІЛЕТАНАМІДУ

Романенко М.І., Іванченко Д.Г., Самура І.Б., Александрова К.В., Макоїд О.Б.

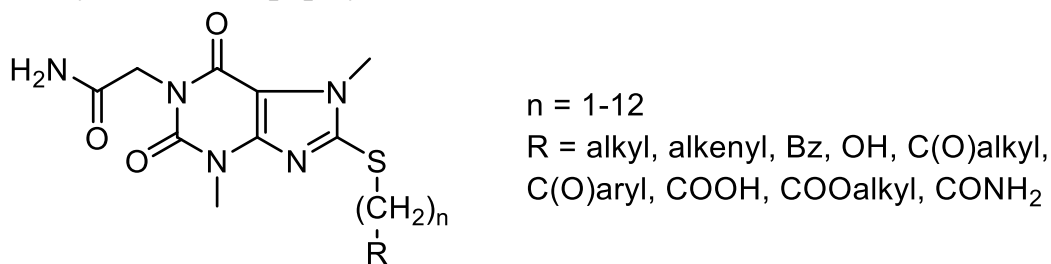
Запорізький державний медичний університет, Запоріжжя, Україна

ivanchenko230181@gmail.com

В практичній медицині широке використання знайшли нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП), які застосовуються для усунення слабкого і помірного болю. Механізм дії всіх аналгетиків-антипіретиків пов'язаний з їх здатністю блокувати активність ферменту циклооксигенази, який забезпечує перетворення арахідонової кислоти в простагландини. Однак НПЗП впливають на синтез простагландинів у різних органах і системах, що обумовлює їх численні небажані ефекти. Показано, що використання препаратів цієї групи призводить до неконтрольованих змін артеріального тиску, ниркової функції, сприяє затримці рідини в організмі. Отже, виходячи із вищенаведеного, можна зробити висновок, що проблема розробки оригінальних вітчизняних препаратів протизапальної та аналгетичної дії є перспективною та актуальною.

Метою даної роботи є розробка методів отримання неописаних раніше в літературі 8-тіопохідних теобромін-1-ілетанаміду – перспективних біоактивних сполук різнобічної дії.

В якості вихідної сполуки був обраний 8-бромотеобромін, отриманий окисним бромованням теоброміну. Взаємодією 8-бромотеоброміну зі хлорацетамідом синтезований 8-бромотеобромін-1-ілетанамід, нагрівання якого з дев'ятиводним натрій сульфідом веде до утворення відповідного 8-тіопохідного. Реакції останнього з галогеналканами, галогеналкенами, бензилгалогенідами, галогенкетонами, галогенспиртами, галогенкислотами та їх функціональними похідними веде до утворення відповідних S-заміщених 8-тіотеобромін-1-ілетанаміду загальної формули:



Будова синтезованих сполук підтверджена даними елементного аналізу, ІЧ- та ПМР-спектроскопії, а індивідуальність контролювалась методом тонкошарової хроматографії.

Гостра токсичність вивчалась за методом Кербера. Біологічний скринінг показав, що синтезовані сполуки відносяться до IV класу токсичності. Аналгетична активність вивчалась на моделі «оцтових корчів», а протизапальна дія – на моделі гострого асептичного набряку. В якості еталонів порівняння використовували диклофенак натрію та анальгін. Аналіз отриманих даних показав, що деякі синтезовані сполуки за показниками знеболюючої та протизапальної дії не поступаються, а іноді перевищують еталони порівняння.

- СИНТЕЗ И ИК-СПЕКТРАЛЬНЫЕ ХАРАКТЕРИСТИКИ
2,5-ДИЗАМЕЩЕННЫХ (6-П-БРОМФЕНИЛ)ИМИДАЗО
[2,1-В][1,3,4]- ТИАДИАЗОЛОВ..... 96**
РАХМОНОВ Р.О., САИДОВ Н.Б., ЗОИДОВА М.Т., МУХИДИНОВ З.К.,
ХОДЖИБАЕВ Ю.
- СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ НА ПРОТИТУБЕРКУЛЬОЗНУ
АКТИВНІСТЬ ДЕЯКИХ АМІДОВАНИХ ПОХІДНИХ
2-(БЕНЗОЇЛАМІНО)(1-*R*-2-ОКСО-1,2-ДИГІДРО-3Н-ІНДОЛ-
3-ІЛІДЕН)ОЦТОВОЇ КИСЛОТИ 97**
РЕБРИК А.О., АЛТУХОВ О.О., ШАПОВАЛОВА О.В., АЛФЕРОВА Д.О.
- СИНТЕЗ ГЕКСИЛ-ПОХІДНИХ СПІРО[ІНДОЛ-3,1'-ПІРОЛО
[3,4-С]ПРОЛ]-2,4',6'-ТРИОНУ, ЇХ АНТИМІКРОБНІ
ВЛАСТИВОСТІ ТА ОЦІНКА *IN SILICO* ЯК ПОТЕНЦІЙНИХ
ІНГІБІТОРІВ СТАФІЛОКОКОВОЇ ДЕГІДРОСКВАЛЕНСИНТАЗИ 98**
РЕДЬКІН Р.Г., ЧЕРНИХ В.П.
- СИНТЕТИЧНІ ДОСЛІДЖЕННЯ З ПОШУКУ БІОАКТИВНИХ
СПОЛУК СЕРЕД ПОХІДНИХ 8-ТІОТЕОБРОМІН-1-ІЛЕТАНАМІДУ .. 99**
РОМАНЕНКО М.І., ІВАНЧЕНКО Д.Г., САМУРА І.Б., АЛЕКСАНДРОВА К.В.,
МАКОЇД О.Б.
- СИНТЕЗ АЛКІЛОВАНІХ ПОХІДНИХ 1-(4-БРОМОФЕНІЛ)-
1,5-ДИГІДРО-4Н-ПІРАЗОЛО[3,4-*D*]ПІРИМІДИН-4-ОНУ
ЯК ПЕРСПЕКТИВНИХ АНТИКОНВУЛЬСАНТІВ 100**
СЕВЕРІНА Г.І., ГЕОРГІЯНЦЬ В.А.
- СИНТЕЗ І ДІУРЕТИЧНА ДІЯ МОНО- ТА ДИМЕТИЛЗАМІЩЕНИХ
7-ГІДРОКСИ-5-ОКСО-2,3-ДИГІДРО-1*H*,5*H*-ПІРИДО[3,2,1-*ij*]
ХІНОЛІН-6-КАРБОКСАНІЛІДІВ..... 101**
СИДОРЕНКО Л.В., УКРАЇНЕЦЬ І.В., ГОЛІК М.Ю., ЧЕРНЕНКО І.М.
- ДОСЛІДЖЕННЯ РЕАКЦІЇ [3+2] ЦИКЛОПРИЄДНАННЯ
У СИНТЕЗІ НОВИХ ПОХІДНИХ 1,4-НАФТОХІНОНУ 102**
СИНГАЄВСЬКИЙ В., СЛЕСАРЧУК М., САМБОРСЬКИЙ В., ШАХ Ю., КАРХУТ А.,
ПОЛОВКОВИЧ С., НОВІКОВ В.
- СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ РЕАКЦІЙНОЇ ЗДАТНОСТІ
ПОХІДНИХ 3-(2-ГІДРОКСИ-2,2-ДИФЕНІЛАЦЕТИЛАМІНО)-
4-ОКСО-2-ТІОКСО-1,2,3,4-ТЕТРАГІДРОХІНАЗОЛІНУ..... 104**
СИТНІК К.М., СТАРІНОВА М.В., КОЛІСНИК С.В.
- ДОСЛІДЖЕННЯ ПРОТИМІКРОБНОЇ ДІЇ *N'*-АРИЛІДЕН-
2-ОКСО-3,3-ДИФЕНІЛ-2,3-ДИГІДРО-1Н-ТІЄНО-[3,4-*b*]
ПРОЛ-6-КАРБОГІДРАЗИДІВ..... 105**
СИТНІК К.М., ОСОЛОДЧЕНКО Т.П., КОЛІСНИК С.В., ЦАПКО Є.О.