

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

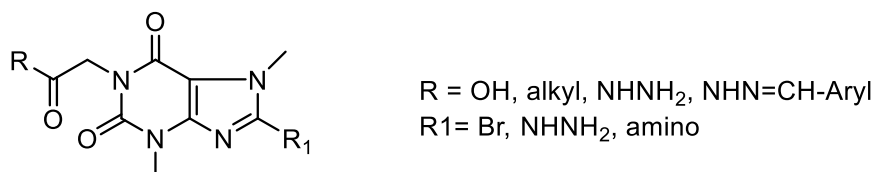
Харків
НФаУ
2018

СИНТЕЗ, РЕАКЦІЇ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ ПОХІДНИХ 8-БРОМОТЕОБРОМІНУ

Іванченко Д.Г., Романенко М.І., Самура І.Б., Шарапова Т.А., Макоїд О.Б.
Запорізький державний медичний університет, Запоріжжя, Україна
 ivanchenko230181@gmail.com

Відомо, що структурна модифікація молекул природних біоактивних сполук може привести до зниження їх токсичності та посилення і урізноманітнення їх фармакологічних ефектів.

З метою пошуку нових лікарських засобів серцево-судинної та бронхолітичної дії нами синтезований ряд 1,8-дизаміщених теоброміну загальної формули:



Вихідні естери 8-бромо(аміно)теобромін-1-ілоцтових кислот отримані взаємодією 8-бромо(аміно)теобромінів з алкілхлорацетатами в середовищі диметилформаміду в присутності поташу. На основі отриманих естерів вивчені їх реакції з нуклеофільними реагентами (гідразингідрат, первинні та вторинні аміни). Встановлено залежність структури продуктів реакції від будови естерового угруповання.

Структура отриманих сполук підтверджена даними елементного аналізу та ПМР-спектроскопії. Чистота синтезованих речовин контролювалась методом тонкошарової хроматографії.

Попередньо були проведені розрахунки молекулярних дескрипторів синтезованих сполук. Було встановлено, що всі одержані сполуки відповідають вимогам «правил п'яти». Також нами був розрахований показник гострої токсичності для щурів та мишей за допомогою комп'ютерних програм GUSAR та ACD/Percepta Platform. За цим показником синтезовані речовини належать до IV класу токсичності. За допомогою PASS-предикції була обрана стратегія досліджень *in vivo*.

Гостра токсичність синтезованих сполук була вивчена за методом Кербера у дослідах на білих мишах. Встановлено, що отримані речовини відносяться до IV класу, що узгоджується з розрахованими даними. Вивчення діуретичної дії отриманих сполук проводили за методом Берхіна Є. Б. (в якості еталонів порівняння використовували гідрохлортіазид та фуросемід). Вивчення протизапальної (антиексудативної) дії проводили згідно з методичними рекомендаціями ДЕЦ МОЗ України. Для скринінгових досліджень застосовували модифікацію карагенінового набряку у мишей. Запалення викликали субплантарним введенням 1% розчину карагеніну. Ефективність застосування тест-зразка оцінювали за пригніченням розвитку набряку лапи у порівнянні з тваринами групи позитивного контролю та дією референс-зразка (диклофенак натрію). Отримані дані свідчать про перспективність даного класу сполук як протизапальних та діуретичних засобів.

ПОШУК НОВИХ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН ПРОТИМІКРОБНОЇ ДІЇ У РЯДУ N-МОРФОЛІН-4-ІЛ-N'-(R-ФЕНІЛ)ТІОСЕЧОВИН	47
Єр'оміна Г.О., Комісаренко А.М., Єр'оміна З.Г., Осолодченко Т.П., Перехода Л.О.	
ПРОТИЗАПАЛЬНІ ВЛАСТИВОСТІ ДЕЯКИХ ПОХІДНИХ N-R-АНТРАНІЛОВИХ КИСЛОТ	48
Жегунова Г.П.	
СИНТЕЗ АНСАМБЛЕЙ ГЕТЕРОЦИКЛОВ, СОДЕРЖАЩИХ ЯДРА 1,2,3-ТРИАЗОЛА, 1,2,4-ТРИАЗОЛА И 1,3,4-ТІАДІАЗОЛА	49
Жуков І.О., Коваленко С.Н.	
ЗАПАЛЕННЯ І СТАРІННЯ. НОВІ МІШЕНІ ТА ПЕРСПЕКТИВИ СТВОРЕННЯ ПРОТИЗАПАЛЬНИХ ПРЕПАРАТІВ	50
Зубков В.О.	
ПОРІВНЯННЯ ОДНОСТАДІЙНОГО І ПОСЛІДОВНОГО МЕТОДІВ СИНТЕЗУ ПІРАНО[3,2-С]ХІНОЛІНІВ	51
Зубков В.О., Сич І.А., Єр'оміна З.Г., Кіз'я О.В.	
СИНТЕЗ И ПРЕВРАЩЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ 1-ГЕТЕРОАРИЛ- 3-(АЦИЛАМИНО-, АЦИЛАМИНОФЕНИЛ-)АДАМАНТАНА	52
Зурабішвілі Д.С., Ломідзе М.О., Гоголашвілі І.Н., Самсонія Ш.А.	
СИНТЕЗ, РЕАКЦІЇ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ ПОХІДНИХ 8-БРОМОТЕОБРОМІНУ	54
Іванченко Д.Г., Романенко М.І., Самура І.Б., Шарапова Т.А., Макоїд О.Б.	
СИНТЕЗ ТА ВИВЧЕННЯ ФІЗИКО-ХІМІЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ 2-((5-ФЕНЕТИЛ-4-R-4H-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛ)ТІО)НІТРИЛІВ.....	55
Ігнатова Т.В., Каплаушенко А.Г., Фролова Ю.С.	
СИНТЕЗ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ ЗАМІЩЕНИХ ПТЕРИДИНТРІОНУ	56
Казунін М.С.	
ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНАЯ АКТИВНОСТЬ НАСТОЯ ИЗ ЛИСТЬЕВ ЕЖЕВИКИ СИЗОЙ	57
Касянюк Е.Ю., Мушкіна О.В.	
ВПЛИВ ЦИТРАТУ ВАНАДІЮ НА ГЕМАТОЛОГІЧНИЙ ПРОФІЛЬ ВАГІТНИХ САМОК ЩУРІВ	60
Климець Г.В., Іскра Р.Я.	
ЦІЛЕСПРЯМОВАНИЙ ПОШУК ОРИГІНАЛЬНИХ АНТИРАДИКАЛЬНИХ АГЕНТІВ У РЯДУ 7-R-8-ГІДРАЗИНОЗАМІЩЕНИХ 1,3-ДИМЕТИЛКСАНТИНУ.....	62
Коробко Д.Б., Романюк А.В., Логойда Л.С.	