

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ



Серія «Наука»

АКТУАЛЬНІ ПИТАННЯ СТВОРЕННЯ НОВИХ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

МАТЕРІАЛИ ВСЕУКРАЇНСЬКОЇ
НАУКОВО-ПРАКТИЧНОЇ КОНФЕРЕНЦІЇ
СТУДЕНТІВ ТА МОЛОДИХ ВЧЕНИХ

19-20 квітня 2012 року
м. Харків

У двох томах

Том I

Харків
НФаУ
2012

СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ СОЛЕЙ ТА ЕСТЕРІВ 2-[4-(2-МЕТОКСИФЕНІЛ)-5-ФЕНІЛ-4H-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛТІО] АЦЕТАТНОЇ КИСЛОТИ

Кучерявий Ю.М., Щербак М.О., Миколасюк О.О., Гоцуля А.С.

Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя

luteus@inbox.ru

Хімічні властивості та біологічна активність нітрогенвмісних гетероциклічних сполук викликають значну увагу науковців. В цьому відношенні вельми актуальними є дослідження похідних 1,2,4-тріазолу, оскільки вони відрізняються незначною токсичністю, широким спектром фармакологічної активності та нескладні у добуванні.

Метою даної роботи був цілеспрямований синтез солей та естерів 2-[4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-4H-1,2,4-тріазол-3-ілтіо]ацетатної кислоти та дослідження їх біологічної дії. Для досягнення поставленої мети вирішувалися наступні завдання: розробити найбільш ефективний спосіб синтезу зазначених сполук, вивчити їх фізико-хімічні характеристики та дослідити можливу біологічну активність.

Синтез відповідних кислот здійснено за відомою схемою: взаємодією попередньо отриманого 2-метоксифенілізотіоціанату з гідразидом бензойної кислоти отримано тіосемікарбазид, який у лужному середовищі піддавався внутрішньомолекулярній циклізації. Надалі було проведено алкілування отриманого тіону кислотою хлорацетатною. Солі відповідної кислоти отримані як з органічними так і неорганічними основами. Естери були отримані взаємодією з спиртами в присутності каталітичної кількості кислоти сульфатної.

Структуру синтезованих сполук встановлено фізико-хімічними методами та підтверджено даними елементного аналізу.

З метою визначення фармакологічного потенціалу синтезованих сполук проведено віртуальний скринінг за допомогою програми PASS. Серед отриманих структур виявлені сполуки з нейролептичною, протизапальною та діуретичною активністю. Встановлені деякі закономірності зв'язку «будова-дія», які можуть бути застосовані для цілеспрямованого пошуку біологічно активних речовин серед похідних 1,2,4-тріазолу.

Таким чином, пошук біологічно активних речовин серед солей та естерів 2-[4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-4H-1,2,4-тріазол-3-ілтіо]ацетатної кислоти є актуальним завданням для сучасної медицини та фармації.