

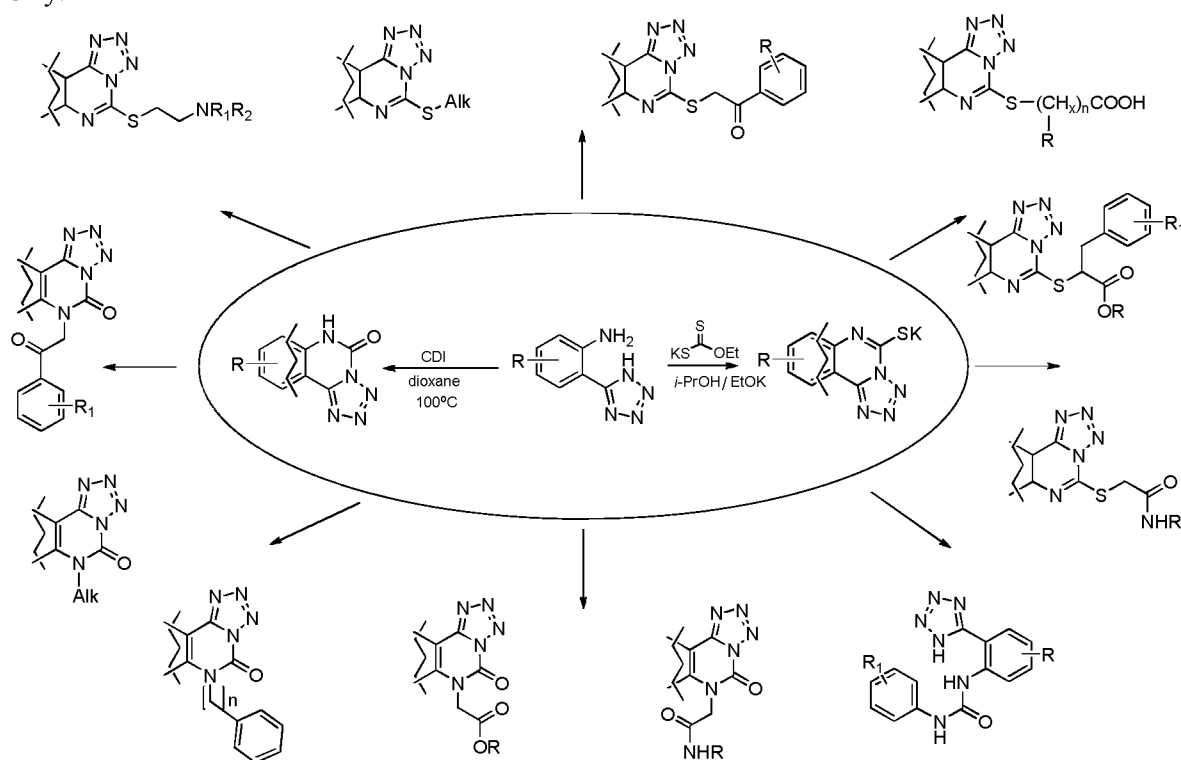
КОМБІНАТОРНА БІБЛІОТЕКА *N*- ТА *S*-ЗАМІЩЕНИХ ТЕТРАЗОЛО[1,5-*c*]-ХІАЗОЛІН-(6*H*)-5-ОНІВ(ТІОНІВ): ДИЗАЙН ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ

Антипенко О. М.¹, Коваленко С. І.¹, Васильєва І. М.²

¹Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя, Україна

²Бактеріологічна лабораторія Запорізької обласної клінічної лікарні, м. Запоріжжя, Україна
e-mail: antypenkoan@gmail.com

У тетразолахіазолінів згідно літературних даних знайдено різноманітні види біологічної дії, зокрема: фунгіцидну, пестицидну, антиалергійну та протиульцерогенну, бактерицидну, бронходилаторну, антигіпертензивну, протизапальну, анальгетичну, антианафілактичну та фібролітичну. Проте, аналіз літературних джерел також виявив, що саме похідні конденсованих тетразола[1,5-*c*]хіазолінів досліджені досить спорадично, через що їх синтез представляє безсумнівний інтерес як для органічної хімії, так для медицини в цілому.



Синтезована комбінаторна бібліотека нових біологічно активних сполук була протестована на наступні види біологічної активності: інгібування біоломінесценції, антибактеріальна, протигрибкова, протипухлинна, гіпоглікемічна, актопротекторна та антигіпоксична дія.

Результати *in silico* молекулярного докінгу та фармакологічний скринінг дозволили виявити, що *N*-арил(бензил, гетерил)-2-(тетразоло[1,5-*c*]хіазолін-5-тіо)ацетаміди були селективними щодо клітинної лінії LOX IMVI меланоми та CCRF-CEM лейкемії, а також проявляють інгібуючу дію відносно протеїнкінази СК2. Тоді як, *N,N*-діалкіл-2-(тетразоло[1,5-*c*]хіазолін-5-ілтіо)алкіламіни виявили протимікробну активність. А фармакологічний скринінг дозволив виявити новий клас сполук з гіпоглікемічною дією серед тетразола[1,5-*c*]хіазолін-5(6*H*)-онів та 1-(2-(1*H*-тетразоло-5-іл)-*R*-феніл)-3-*R*₁-феніл(етил)-сечовин. Крім того, найбільш виражена актопротекторная дія була у натрію 2-(тетразоло[1,5-*c*]хіазолін-5-ілтіо)ацетату. Таким чином, очікуваний біологічний потенціал тетразола[1,5-*c*]-хіазолін-(6*H*)-5-онів(тіонів) був виправданий.