

КАРБОКСИЛВМІСНІ [1,2,4]ТРИАЗИНО[2,3-С]ХІНАЗОЛІНИ – ПЕРСПЕКТИВНИЙ КЛАС БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ СПОЛУК.

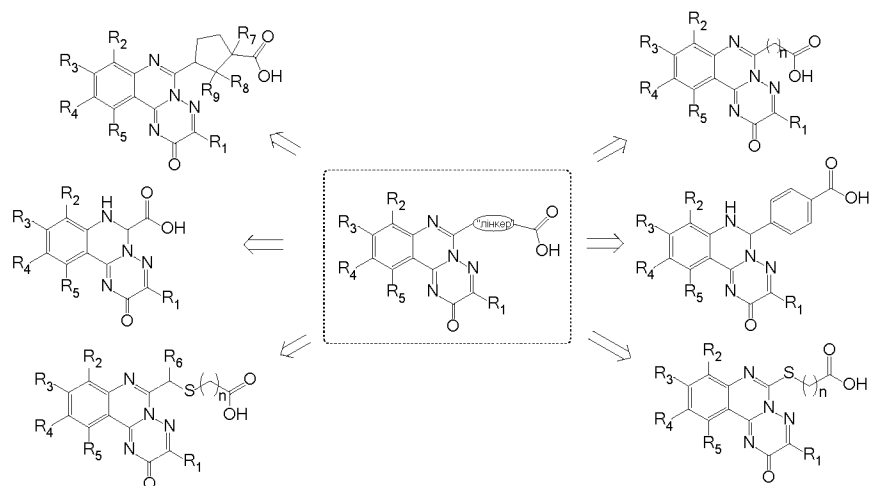
Воскобойнік О. Ю.¹, Якубовська В. В.², Носуленко І. С.¹, Берест Г. Г.¹, Скорина Д. Ю.¹, Коваленко С. І.¹, Степанюк Г. І.², Степанюк Н. Г.²

¹Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя, Україна

²Вінницький національний медичний університет, м., Вінниця, Україна

e-mail: kovalenkosergiy@gmail.com

Сполуки, що містять карбоксильну групу завжди вважались перспективними об'єктами досліджень спрямованих на створення нових лікарських засобів. Така висока увага пов'язана як з тим фактом, що зазначений функціональний фрагмент є фармакофором, так і вкрай широкими можливостями його хімічної модифікації. Враховуючи зазначене, та в продовження наших досліджень, спрямованих на пошук біоактивних сполук серед конденсованих похідних хіназоліну, нами здійснено синтез ряду перспективних карбоксилвмісних [1,2,4]триазино[2,3-с]хіназолінів. Використання оригінального методу синтезу, а саме модифікації заміщених 3-(2-амінофеніл)-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-онів дозволило одержати широкий ряд сполук, що містять в положенні 6 карбоксильну групу поєднану з гетероциклічним фрагментом алкільним, циклоалкільним, тіоалкільним, алкілтіоалкільним та арильним «лінкерними» фрагментами. Синтезовані сполуки дослідженні на наявність анагетичної, протизапальної, протиішемічної, актопротекторної, гіпоглікемічної дії.



Особливу увагу привертають до себе результати дослідження протизапальної дії ряду заміщених (3-R-2-оксо-2H-[1,2,4]триазино[2,3-с]хіназолін-6-іл)алкілкарбонових кислот. Так, згідно експериментальних даних названий клас сполук виявляє протизапальну дію, що в ряді випадків перевищує активність препаратів порівняння (диклофенак). Проведені дослідження методами молекулярного докінгу дозволили встановити ймовірний механізм протизапальної дії синтезованих сполук, а аналіз взаємозв'язку «будова – біологічна дія» дозволила встановити вплив будови алкільного лінкеру та замісників у бензольному фрагменті триазинохіназолінової системи на рівень протизапальної дії. За результатами досліджень виявлено та рекомендовано до поглибленого вивчення сполуку, яка на фоні низької токсичності виявляє виражену протизапальну та анагетичну дію.