

СИНТЕЗ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ 3-(АЛКІЛТІО)-4-R-5-(ТІОФЕН-2-ІЛМЕТИЛ)-4Н-1,2,4-ТРІАЗОЛІВ

Сугак О. А., Сафонов А. А., Панасенко О. І., Книш Є. Г.

Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя, Україна

Останнім часом пошук та синтез нових сполук із високою біологічною активністю, які можуть стати потенційною основою для лікарських засобів, все більше привертають значну увагу науковців. Особливу зацікавленість у даному напряму викликають сполуки гетероциклічної структури як високоефективні фармакологічно активні сполуки. Інтерес науковців поширюється завдяки низькій токсичності та високій реакційній здатності системи 1,2,4-тріазолу. Учені стверджують, що найбільш ефективними є похідні із різними фармахофорами при третьому та п'ятому положеннях гетероциклу. Доведено, що поєднання ядра тріазолу з іншими гетероциклічними системами, особливо при п'ятому положенні, викликає посилення біологічної дії, а іноді появі нових фармакологічних активностей. Серед гетероциклічних препаратів у медицині широко застосовуються похідні 1,2,4-тріазолу, що мають різноманітні види біологічної активності.

Так, вже відомі сполуки з противірусною, протизапальною, гепатопротекторною активністю. Великі перспективи розвитку 1,2,4-тріазолів у сільському господарстві. Деякі сполуки проявляють високу рістактивуючу активність. Відомі дані щодо застосування 1,2,4-тріазолів у якості фунгіцидів та гербіцидів.

Дослідження вчених Запорізького державного медичного університету є яскравим прикладом перспективності пошуку нових біологічно активних сполук серед похідних 1,2,4-тріазолу. Масштабні наукові випробування даного ряду сполук за останнє десятиліття є вагомим вкладом у розвиток сучасної вітчизняної фармацевтичної галузі.

Але ще недостатньо вивчені 3-(алкілтіо)-4-R-5-(тіофен-2-ілметил)-4Н-1,2,4-тріазоли.

Тому метою нашої роботи був синтез, дослідження фізико-хімічних та біологічних властивостей 3-(алкілтіо)-4-R-5-(тіофен-2-ілметил)-4Н-1,2,4-тріазолів, де R – аміно, феніл, етил, метил.

Матеріали та методи досліджень. Проведено реакції алкілювання галогеналканами (1-бромпропан, 1-бромбутан, 1-бромпентан, 1-бромгексан, 1-бромгептан, 1-бромоктан, 1-бромнонан, 1-бромдекан) у середовищі і-пропанолу 4-аміно-5-(тіофен-2-ілметил)-4Н-1,2,4-тріазол-3-тіолу та 4-R-5-(тіофен-2-ілметил)-4Н-1,2,4-тріазол-3-тіолів, де R - феніл, етил, метил. Досліджено протимікробну, протигрибкову, аналгетичну, актопротекторну активності. Протимікробну та протигрибкову активність визначали методом «серійних розведень». Вивчення аналгетичної активності проводили методом «гаряча пластина». Актопротекторну дію визначали методом примусового плавання.

Статистичну обробку результатів проводили за допомогою методів параметричної статистики (t-критерію Стьюдента).

Результати та їх обговорення. Сучасними фізико-хімічними методами (елементний аналіз, 1Н-ЯМР-спектроскопія, ВЕРХ-МС) доведено будову синтезованих сполук. Досліджено протимікробну, протигрибкову, аналгетичну, актопротекторну активності.

Висновки. У результаті проведених досліджень синтезовано 3-(алкілтіо)-4-R-5-(тіофен-2-ілметил)-4Н-1,2,4-тріазоли, де R – аміно, феніл, етил, метил. Доведено будову отриманих речовин. Синтезовані сполуки проявляють помірну протимікробну, протигрибкову, аналгетичну, актопротекторну активність.