

Гостра токсичність синтезованих сполук була вивчена за методом Кербера. Первинний фармакологічний скринінг показав, що синтезовані сполуки відносяться до IV класу токсичності. Вивчення діуретичної дії отриманих сполук проводили за методом Берхіна Є. Б. (в якості еталонів порівняння використовували гідрохлортіазид та фуросемід). Отримані дані свідчать про перспективність даного класу сполук як діуретичних засобів.

## **СИНТЕЗ, ПЕРЕТВОРЕННЯ, ФІЗИКО-ХІМІЧНІ ТА БІОЛОГІЧНІ ВЛАСТИВОСТІ СОЛЕЙ 2-[4-(2-МЕТОКСИФЕНІЛ)-5-ФЕНІЛ-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛТІО]АЦЕТАТНИХ КИСЛОТ**

Приємець Н.С.

Науковий керівник: к.фарм.н. Гоцуля А.С.  
Запорізький державний медичний університет  
Кафедра токсикологічної та неорганічної хімії

**Метою роботи** був пошук сполук з протимікробною активністю серед солей 2-[4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-1,2,4-тріазол-3-ілтїо]ацетатної кислоти. Для реалізації поставленої мети було синтезовано 4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-1,2,4-тріазол-3-тіол; проведено реакції алкілування отриманого тіолу кислотою  $\alpha$ -хлорацетатною; для біологічних досліджень синтезовані солі 2-(4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-1,2,4-тріазол-3-ілтїо)ацетатної кислоти.

**Матеріали та методи дослідження.** Хімічні методи (реакції алкілування, нуклеофільного заміщення), фізико-хімічні методи (елементний аналіз, ІЧ- і УФ-спектрофотометрія  $^1\text{H}$  ЯМР- та хромато-мас-спектрометрія), біологічні методи (визначення гострої токсичності та протимікробної активності), бібліосемантичний метод.

**Отримані результати.** Синтезовано 13 солей. За методом Прозоровського на гостру токсичність досліджено 5 сполук. Методом «серійних розведень» отримані результати щодо чутливості *Staphylococcus aureus* 209-P, *Escherichia coli* 675, *Proteus vulgaris* 5, *Bacillus anthracoides* 1312, *Pseudomonas aeruginosa* 165 до синтезованих сполук.

**Висновки.** Встановлені оптимальні умови отримання солей 2-[4-(2-метоксифеніл)-5-феніл-1,2,4-тріазол-3-ілтїо]ацетатної кислоти. Синтезовані солі відносяться до класу малотоксичних або практично нетоксичних сполук. Найчутливішим серед штамів мікроорганізмів є *Bacillus anthracoides*. Найактивнішим за інші виявився моноетаноламоній 2-[5-феніл-4-(2-метоксифеніл)-1,2,4-тріазол-3-ілтїо]ацетат.

## **БИОФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ИССЛЕДОВАНИЯ МЯГКОЙ РЕКТАЛЬНОЙ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ФОРМЫ ПРАЗИКВАНТЕЛА**

Романина Д. М.

Научный руководитель: проф. Гладышев В.В.  
Запорожский государственный медицинский университет  
Кафедра технологии лекарств

Акнеподобные дерматозы, такие как розацеа, периоральный дерматит, розацеаподобный дерматит, себорейный дерматит и др. имеющие сходные клинические проявления остаются одной из самых актуальных проблем дерматологии. Одним из патогенетических факторов этих заболеваний является клещевая инвазия (*Demodex folliculorum*). При наличии демодекоза у больных акнеподобными дерматозами течение заболевания характеризуется большей выраженностью клинических симптомов и достоверным увеличением частоты рецидивов.

Среди системных лекарственных средств, применяющихся при терапии акнеподобных дерматозов, осложненных демодекозом наиболее часто практической дерматологией используются препараты патогенетической терапии - производные имидазола (метронидазол, тинидазол, орнидазол и др.).

В связи с вышеизложенным представляет интерес поиск новых биологически активных веществ, обладающих антидемодексной активностью, низкой токсичностью и создание на их основе соответствующих лекарственных форм.

Празиквантел – вещество, проявляющее антипаразитарный эффект в отношении трематод и цестод. В исследованиях отечественных ученых выявлена высокая специфическая антидемодексная активность празиквантела и установлена клиническая эффективность его таблетированной формы «Бильтрицид» (ФРГ) в системной терапии акнеподобных дерматозов, более чем в два раза сокращающая сроки лечения по сравнению с метронидазолом.

В связи с этим актуальным является создание лекарственной формы празиквантела на основе отечественных технологий. При этом в связи с достаточно широким спектром побочных явлений при пероральном введении празиквантела целесообразным является использование альтернативного трансмукозного пути введения лекарственного вещества, в частности ректального в соответствующих лекарственных формах (суппозиториях).

Целью настоящей работы является изучение влияния вспомогательных веществ (суппозиторных основ-носителей и поверхностно-активных веществ) на биофармацевтические характеристики ректальной лекарственной формы празиквантела.

Нами проведены исследования влияния вида основы-носителя и поверхностно-активных веществ на высвобождаемость празиквантела из ректальных суппозиториях методом равновесного диализа по Кривчиньскому в спирт этиловый. Установлено, что вид основы-носителя и вид поверхностно-активных веществ оказывают значимое влияние на высвобождение празиквантела из ректальных суппозиториях. Выявлено, что влияние вида поверхностно-активных веществ на данный процесс более значимо, чем вид основы-носителя. При этом взаимодействие между данными фармацевтическими факторами статистически значимо, но воздействует на высвобождение празиквантела в меньшей степени, чем изучаемые фармацевтические факторы. Дисперсионный анализ результатов исследований показал, что оптимальное высвобождение празиквантела из суппозиториях ректальных обеспечивает композиция заводской жировой основы и моноглицеридов дистиллированных.

### **ДОСЛІДЖЕННЯ АНТИГІПОКСИЧНОЇ ДІЇ ПОХІДНИХ (3-ТІО-4-R-1,2,4-ТРИАЗОЛ-5-ІЛ)(ФЕНІЛ)МЕТАНОЛІВ**

Рудь А.М.

Науковий керівник д.фарм.н., доц. Каплаушенко А.Г.

Запорізький державний медичний університет

Кафедра фізикоїдної хімії

Усунення екстремальних киснедефіцитних станів є дуже актуальною проблемою при лікуванні серцево-судинних захворювань (ішемій, інфарктів, інсультів). Перелік сучасних антигіпоксичних засобів залишається досить обмеженим (емоксипін, мексидол, убінон, оліфен і ін.) для терапії різних киснезалежних патологічних станів, а препарати не є універсальними, не завжди ефективні і мають деякі побічні ефекти. З метою усунення явищ гіпоксії використовується цілий ряд препаратів, антигіпоксична дія яких є супутнім ефектом (пантогам, пірацетам та ін.).

Проте, вищевказані лікарські засоби мають широкий спектр побічних дій: тахікардія, зниження артеріального тиску, емоційна лабільність, диспептичні явища, блювання, астенія, головний біль, порушення координації рухів.

Між тим, частота гіпоксичних станів та широкий спектр факторів, що їх спричиняють, зумовлюють актуальність пошуку нових засобів і методів подолання кисневої недостатності.

На сьогоднішній день відомо, що похідні 1,2,4-тріазолу здатні проявляти цитопротективну дію, при цьому володіють низькою токсичністю. Для ряду 2-(5-(гідроксифенілметил)-4-R-1,2,4-тріазол-3-ілтіо)етанових (гетерил карбонових) кислот були проведені дослідження антигіпоксичної дії. Результати свідчать про високі показники вищезгаданої активності характерні даним сполукам.

На даний момент ведуться розробки методів структурної модифікації сполук за карбоксильною групою, та дослідження біологічної активності.

### **РАСЧЕТЫ ВЗАИМОСВЯЗИ СТРУКТУРА-АКТИВНОСТЬ АНТИОКСИДАНТНЫХ СВОЙСТВ В ОТНОШЕНИИ ПЕРОКСИНИТРИТА У ПРОИЗВОДНЫХ 3- АРИЛ(АРАЛКИЛ)КСАНТИНА С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ КВАНТОВО-ХИМИЧЕСКИХ, ФИЗИКО-ХИМИЧЕСКИХ И ПРОСТРАНСТВЕННЫХ ДЕСКРИПТОРОВ**

Рыженко В.П.

Научный руководитель: проф. Рыжов А.А.

Запорожский государственный медицинский университет

Кафедра медицинской и фармацевтической информатики

Гиперпродукция активных форм кислорода, в частности супероксид радикала, в условиях недостаточности антиоксидантной защиты организма является одним из основных патогенетических механизмов развития ряда заболеваний. Негативный эффект супероксид радикала проявляется как в прямом окислительном влиянии на ферментативные системы, так и опосредованном – за счет