

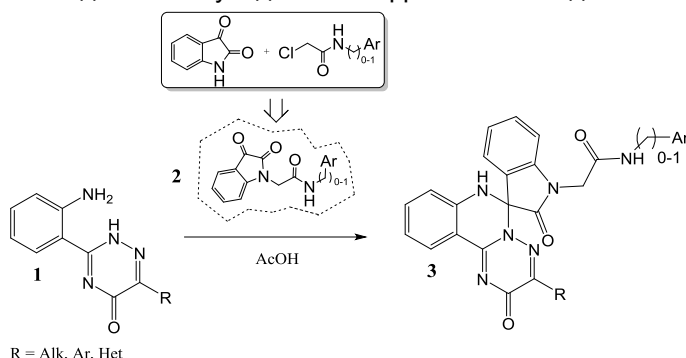
2-нітробензальдегід, 3-нітро-бензальдегід). Отримані сполуки є білими або жовтими кристалічними речовинами, добре розчинними у ДМФА та суміші н-пропанол – вода (3:1). Структуру отриманих сполук підтверджено за допомогою сучасних фізико-хімічних методів аналізу: ¹H ЯМР-спектроскопії, ІЧ-спектроскопії, елементного аналізу та хромато-мас-спектрометрії. Проведено комп'ютерне прогнозування біологічної активності та гострої токсичності отриманих сполук за допомогою програм «PASS Online®» та «GUSAR Online®» і встановлено доцільність подальших досліджень.

СПІРОКОНДЕНСОВАНІ ПОХІДНІ [1,2,4]ТРИАЗИНО[2,3-С]ХІНАЗОЛІНОВОЇ СИСТЕМИ, ЩО МІСТЯТЬ ІНДОЛЬНИЙ ФРАГМЕНТ – НОВИЙ КЛАС ПОТЕНЦІЙНИХ ХІМІОТЕРАПЕВТИЧНИХ АГЕНТІВ

Коломоєць О.С.

Науковий керівник: проф. Коваленко С.І.
Запорізький державний медичний університет
Кафедра органічної та біоорганічної хімії

Як відомо, розробка нових хіміотерапевтичних препаратів є однією з найбільш актуальних, та водночас складних проблем, що стоять перед сучасною медичною хімією. Серед стратегій створення нових хіміотерапевтичних агентів, до найбільш поширених відноситься фармакофор-гібридний метод, який передбачає поєднання в одній молекулі декількох фрагментів з відомою біологічною дією.



В рамках реалізації зазначеного підходу, нами конденсацією 3-(2-амінофеніл-6-R-1,2,4-триазин-5(2H)-онів (1) з N-арил(бензил)-2-(2,3-діоксоіндолін-1-іл)ацетамідами (2) в оцтовій кислоті одержано ряд спіроконденсованих похідних (3). Останні поєднують в своїй структурі фармакофорні індольний та [1,2,4]триазино[2,3-с]хіназоліновий фрагменти, що дає підстави прогнозувати їх високу біологічну активність. Структура синтезованих сполук підтверджено комплексом фізико-хімічних методів, зокрема ¹H та ¹³C ЯМР-, мас-, ІЧ, хромато-мас-спектрометрично. Для синтезованих сполук планується провести скринінгові дослідження спрямовані на виявлення їх протимікробної, протигрибкової та протиракової дії.

ДОСЛІДЖЕННЯ ГІПОГЛІКЕМІЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ 5-(ФЕНОКСИМЕТИЛЕН)-4-R-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОНІВ

Кучерявий Ю.М., Клеванова В.С., Лихненко А.В., Лихненко Ю.В.

Наукові керівники: д.фарм.н., доц. Каплаушенко А.Г.¹, д.біол.н., доц. Тржецинський С.Д.²
Запорізький державний медичний університет

¹Кафедра фізикоїдної хімії

²Кафедра фармакогнозії, фармакології та ботаніки

На сьогоднішній день цукровий діабет є однією з важливих проблем медицини всього світу та України зокрема. Число хворих з даним захворюванням в нашій країні сягає близько 1 млн., при цьому 90 % пацієнтів – це люди з II типом цукрового діабету. Хоча на українському фармацевтичному ринку і представлено широкий асортимент цукрознижуючих лікарських засобів, кожен з них має ряд своїх недоліків. Тому пошук нових гіпоглікемічних лікарських засобів є актуальним завданням для науковців фармацевтичної галузі. Метою нашого дослідження став синтез та первинний фармакологічний скринінг гіпоглікемічних властивостей похідних 5-(феноксиметилєн)-4-R-1,2,4-тріазол-3-тіонів (R=H, C₂H₅, C₆H₅). Серед синтезованих класів сполук, що були рекомендовані до фармакологічних досліджень можна виділити нітрили, іміноестери, 3-тіоалкілпохідні, солі 3-ілітіоацетатних кислот та ін. Дані речовини були отримані за відомими методиками та деякі класи описані у попередніх роботах. Ймовірно цукрознижуючу активність синтезованих сполук оцінювали за зміною концентрації глюкози в крові піддослідних тварин після одноразового введення. В якості інтактних тварин були використані лабораторні щури лінії Wistar. Сполуки вводили за допомогою зонду *per os* в кількості 1/10 від молекулярної маси. При цьому тварини були розділені на 3 групи по 6 піддослідних у кожній. Контрольній групі вводили воду очищену в еквівалентній кількості. Сполука порівняння – гліцепірид, експрес-аналізатор – глюкометр “Gamma MINI”. Аналіз крові проводили через 2, 4, 6 та 8 годин після введення зразку. Після статистичної обробки результатів були виявлені сполуки, що перевищують показники референтного препарату. Продовжується подальший гіпоглікемічний скринінг нових синтезованих класів сполук на основі 5-(феноксиметилєн)-4-R-1,2,4-тріазол-3-тіонів.