

СИНТЕЗ ТА ПРОТИСУДОМНА АКТИВНІСТЬ ЗАМЩЕНИХ ПОХІДНИХ 2-АМІНО-5-ЕТИЛТІО-1,3,4-ТІАДІАЗОЛУ

Сич І. В., Драпак І. В., Єршоміна З. Г., Гриневи́ч Л. О., Перехода Л. О.

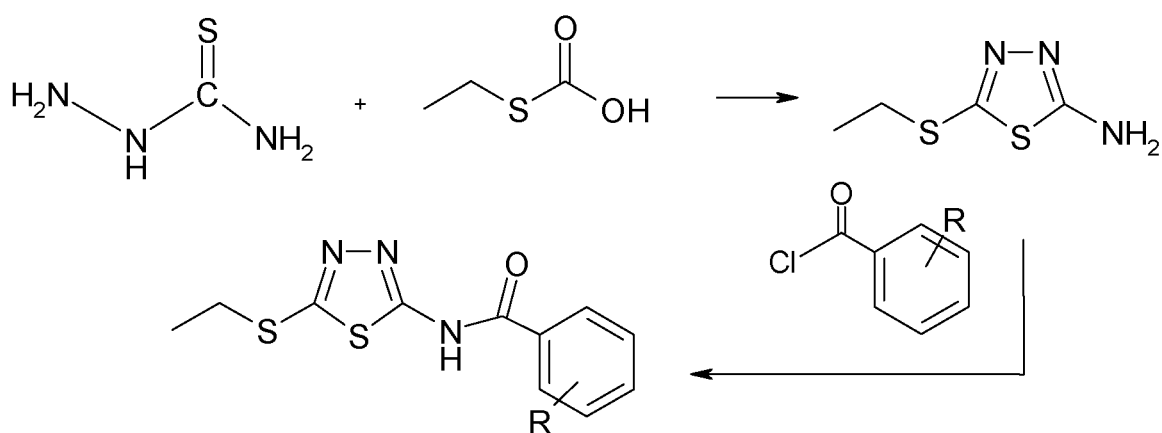
Харківський науково-дослідний інститут судових експертиз

ім. Засл. проф. М. С. Бокаріуса, м. Харків, Україна

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

Львівський національний медичний університет імені Данила Галицького, м. Львів, Україна

Незважаючи на успіхи сучасної фармакології останніх десятиліть, застосування існуючих антиконвульсантів навіть останнього покоління пов'язане з відносно високою частотою небажаних ефектів і ризиком розвитку серйозних побічних реакцій. Тому зберігається потреба у створенні нових ефективних лікарських засобів для лікування епілепсії зі сприятливим профілем безпеки. З метою пошуку нових потенційних антиконвульсантів були синтезовані нові 2-амінопохідні 5-етилтіо-1,3,4-тіадіазолу.



Реакцією циклізації тіосемікарбазиду та 2-тіобутанової кислоти був отриманий вихідний 2-аміно-5-етилтіо-1,3,4-тіадіазол, який без додаткового очищення вводили в реакцію з хлорангідрідами ароматичних кислот. Задовільні виходи кінцевих продуктів у реакції ацетилювання (70-80%) одержані у безводному піридині.

Отримані сполуки являють собою білі кристалічні сполуки, які мають чіткі температури плавлення, розчинні в етанолі при нагріванні та не розчинні у воді. Будову отриманих сполук доводили сучасними фізико-хімічними методами ІЧ- та ¹Н ЯМР-спектроскопії, чистоту доводили методом тонкошарової хроматографії. Для оптимізації експериментального фармакологічного скринінгу був проведений комп'ютерний прогноз активності синтезованих сполук за допомогою програми PASS *online*. Згідно результатів прогнозу усі синтезовані похідні є перспективними для проведення експериментального скринінгу на протисудомну активність.

Висновки. Синтезовані 8 не описаних у літературі похідних 2-аміно-5-етилтіо-1,3,4-тіадіазолу. Первинний фармакологічний скринінг отриманих сполук на протисудомну активність знайшов підтвердження на подальшу перспективність дослідження даної групи сполук.