

ВІДКРИВАЄМО НОВЕ СТОРІЧЧЯ: ЗДОБУТКИ ТА ПЕРСПЕКТИВИ

синтезованих речовин було підтверджено сучасними фізико-хімічними методами аналізу, а саме проведено УФ-, ІЧ-, ПМР-спектроскопія, хромато-маспектрометрія, елементний аналіз. Для більшості синтезованих сполук проведено первинні скринінгові дослідження біологічних властивостей.

Висновки. Згідно поставленої мети було отримано ряд нових перспективних S-похідних тіофенвмісних 1,2,4-триазолів. Досліджено та підтверджено будову усіх синтезованих сполук. Деякі сполуки після первинного фармакологічного скринінгу було передано для подальших досліджень.

РОЗРОБКА НОВИХ ПІДХОДІВ ДО СИНТЕЗУ β -АМІДІВ КАМФОРНОЇ КИСЛОТИ

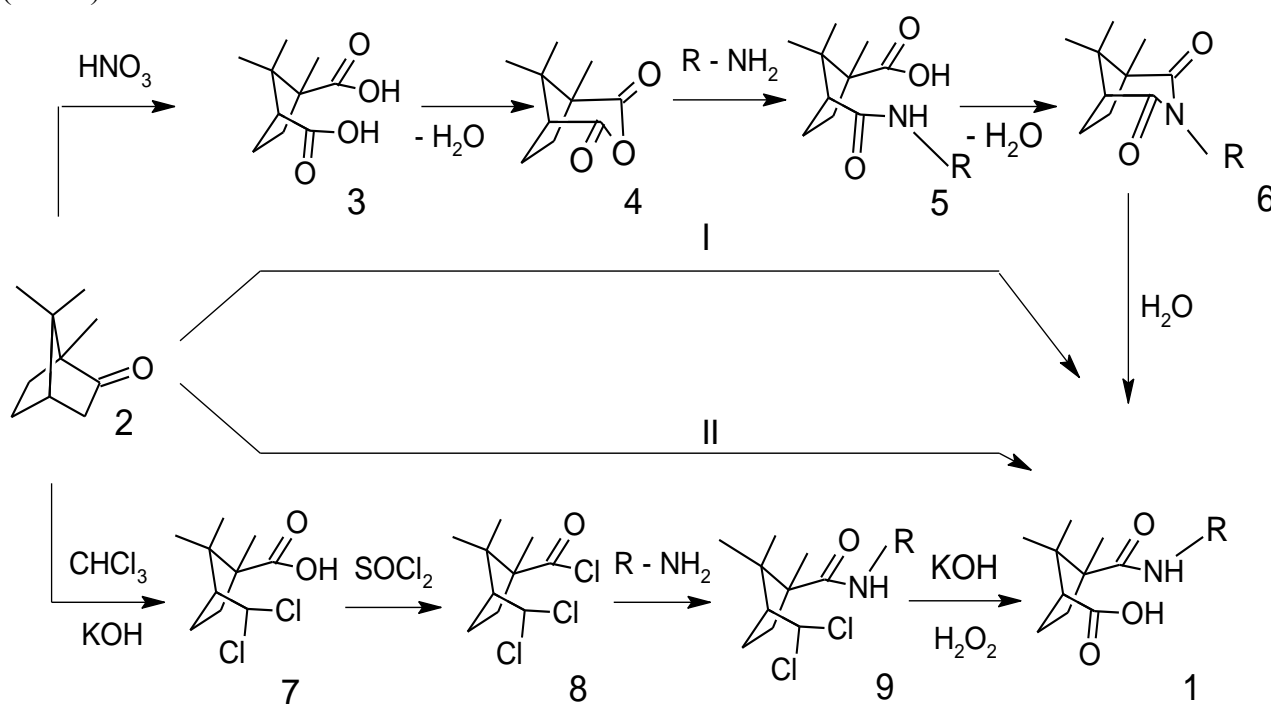
Цапко Є. О., Ситнік К. М., Тітко Т. О., Ковальська О. В.

Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна

evgentsapko@ukr.net

Вступ. Похідні камфорої кислоти відомі своєю біологічною активністю. Отже, розробка ефективних методів синтезу цього класу сполук є актуальною задачею.

Мета дослідження. Розробка нових методів синтезу β -амідів камфорої кислоти **1** (схема).



R - арил

Матеріали та методи. На сьогодні відомим методом синтезу цільового класу амідів **1** є синтез з камфори **2**, який представлений на схемі як спосіб I. Проміжними продуктами є камфорова кислота **3**, камфоровий ангідрид **4**, α -амід **5** та імід **6**. Спосіб включає п'ять стадій, з яких перша є найбільш тривалою (48-64 год) та проходить з виходом до 40%.

Отримані результати. Нами запропонований спосіб II, в якому використовується розщеплення камфори **2** з утворенням 3-дихлорометил-1,2,2-триметилкарбонової кислоти **7**, з

наступним синтезом її хлорангідриду 8 та амідів 9. Остання стадія способу II полягає у гідролізі дихлорметильної групи амідів 9 з одночасним окисленням та утворенням цільового продукту 1. Описаний спосіб синтезу апробований на ароматичних амідах. Його перевагою є менша кількість стадій та експресність.

Висновки. Запропонований новий ефективний спосіб синтезу β -амідів камфорної кислоти.

ВИВЧЕННЯ АНТИЕКСУДАТИВНОЇ АКТИВНОСТІ КОМПОЗИЦІЙ N-(4-БУТИЛФЕНІЛ)-2-[4-АМІНО-5-(ПІРИДИН-4-ІЛ)-4H-1,2,4-ТРИАЗОЛ- 3-ІЛТІО]АЦЕТАМІДУ З 1,3,7-ТРИМЕТИЛКСАНТИНОМ

Чаленко Н.М.¹, Демченко А.М.², Сирова Г.О.¹

¹Харківський національний медичний університет, Харків, Україна

²"Ніжинський державний університет ім. Миколи Гоголя", Ніжин, Україна
nm.chalenko@knu.edu.ua

Вступ. Сучасна фармація ставить за мету акцентувати увагу на створенні нових сучасних вітчизняних фармацевтичних засобів і мінімізувати токсичність ліків, які були б більш ефективними відносно їх активності і відносно нетоксичними. Тому пошук нових лікарських засобів фармакологічно активних з мінімальною кількістю побічних явищ є актуальною задачею сучасної фармації. На сьогодні відомо, що гетероциклічна система 1,2,4-триазолу є перспективним фрагментом для синтезу нових біологічно активних речовин (БАР) із різними видами фармакологічної дії, зокрема а антиексудативної (АеА).

У лікарській практиці часто застосовується комбінована фармакотерапія з метою підвищення ефективності лікарського препарату. Комбінована дія спостерігається при використанні поєднань лікарських фармацевтичних компонентів з метою підвищення терапевтичного ефекту, скорочення терміну лікування і запобігання ускладнень. При комбінованому застосуванні основні ефекти, як правило, змінюються за рахунок їх взаємодії на рівні фармакокінетичних процесів (всмоктування, розподіл, метаболізм, виділення) або фармакодинамічних реакцій, які проявляються у вигляді синергізму або антагонізму. Можливість одержання більш значної фармакологічної активності від комбінації БАР у порівнянні з їх моновведенням стала підґрунтям для створення нових фармацевтичних композицій.

Мета дослідження. З аналізу літературних джерел та наших попередніх досліджень було виявлено, що часто до складу лікарських засобів з комбінованих протизапальною та протибольовою діями входить 1,3,7-триметилксантин (кофеїн). Тому у нашому дослідженні ми поставили за мету створити нову фармацевтичну композицію N-(4-бутилфеніл)-2-[4-аміно-5-(піридин-4-іл)-4H-1,2,4-триазол-3-ілтїо]ацетаміду (сполука 1) з кофеїном (сполука 2) та дослідити її вплив на АеА щурів в умовах формалінового набряку (ф.н.).

Матеріали та методи. Для вивчення АеА були проведені дослідження, задачею яких була порівняльна оцінка дії сполуки 1, її композиції зі сполукою 2. Референс-препаратом було обрано відомий НПЗЗ диклофенак натрію.

АеА вивчали на білих щурах-самцях за допомогою експериментальної моделі формалінового набряку. Тварини були поділені на 5 груп по 6 тварин у кожній групі. Набряк