

внутрижелудочно в дозе 8 мг/кг, анальгин (метамизол натрия) вводили крысам внутрижелудочно однократно в дозе 50 мг/кг.

Установлено, что большинство соединений проявляют достаточно слабую антиэкссудативную активность.

Достоверная противовоспалительная активность, которая статистически значимо отличается от показателей группы контрольной патологии выявлена у трех соединений, под лабораторными шифрами № 8, № 16, № 34 и составляет 32,7%, 60,4% и 28,8% соответственно.

Среди исследуемых производных 4-(адамантил-1)-тиазолил-2-амида щавелевой кислоты (соединения 31 – 36), максимальное антиэкссудативное действие проявляют молекулы под шифром № 35 и № 34, показатели которых составляют 25,8% и 28,8% соответственно. Причем, последняя имеет статистически значимые отличия от группы контрольной патологии.

Максимальная способность влиять на процесс воспаления, на уровне препарата сравнения – вольтарена, установлена для соединения № 16 (ди-(2,4-диметил) анилид малоновой кислоты).

Полученные результаты эксперимента позволяют установить закономерности противовоспалительного действия от химической структуры молекулы для новых соединений и отобрать для дальнейших фармакологических исследований соединение № 16 (ди-(2,4-диметил) анилид малоновой кислоты, которое проявило максимальное противовоспалительное действие.

QSAR-АНАЛІЗ СУБСТАНЦІЙ З НООТРОПНОЮ АКТИВНІСТЮ, ЩО МІСТЯТЬ В СВОЇЙ СТРУКТУРІ 2-ОКСОІНДОЛІНОВИЙ ФРАГМЕНТ

Колісник С.В., Свєчнікова О.М., Винник О.Ф., Мальцева Т.І., Савицька М.В.

Кафедра аналітичної хімії

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

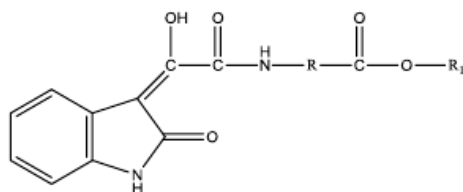
Кафедра хімії

Харківський Національний педагогічний університет ім. Г.С. Сковороди, м. Харків, Україна

vph_secretary@mail.ru

Мета: дослідження впливу ліпофільності деяких похідних аліфатичних амінокислот, що містять в своїй структурі 2-оксоіндоліновий фрагмент на прояв ними ноотропної дії.

Матеріали та методи: методом молекулярної спектрофотометрії визначені коефіцієнти розподілу 27 складних естерів аліфатичних амінокислот, до структури яких входить 2-оксоіндоліновий фрагмент:



где R = CH₂; (CH₂)₂; (CH₂)₃; (CH₂)₄; (CH₂)₅; CH(CH₃); CH(CH(CH₃)₂);
CH(CH₂CH(CH₃)₂); CH₂CH(C₆H₅)CH₂; R₁ = CH₃; C₂H₅; C₃H₇

Результати. Аналіз впливу структури молекул досліджуваних сполук на їх ліпофільні властивості показав, що збільшення кількості метиленових груп в аліфатичному фрагменті амінокислот приводить до зростання їх гідрофобності. Зміна структури вуглеводневого радикалу в складноестерному фрагменті молекул збільшує ліпофільні властивості у відповідності зі збільшенням розміру вуглеводневого радикалу.

Скринінг-контроль фармакологічної активності даної групи сполук показав, що за рівнем ноотропної дії вони перевершують активність пірацетама, гліцину та гамма-аміномасляної кислоти. Аналіз впливу ліпофільних властивостей на рівень прояву ними ноотропної активності дозволив зробити висновок, що найбільш активними є сполуки, що мають максимальну гідрофільність в даному ізоструктурному ряді.

Висновки:

1. Проаналізовано вплив структури молекул похідних аліфатичних амінокислот на їх ліпофільні властивості.
2. Встановлений вплив ліпофільних властивостей на ноотропну активність аліфатичних амінокислот.
3. Одержані дані враховуються для молекулярного дизайну активних ноотропів в даному ізоструктурному ряді.

ЗАЛЕЖНІСТЬ «СТРУКТУРА - МІКРОБІОЛОГІЧНА ДІЯ» У РЯДУ ФУНКЦІОНАЛЬНИХ ПОХІДНИХ N-R-АМІНІВ

Голік М.Ю., Криськів О.С.*

Кафедра аналітичної хімії, кафедра неорганічної хімії,*

Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

У сучасній практиці конструювання нових лікарських засобів важливу роль відіграє встановлення кількісного зв'язку між структурою речовини і її властивостями шляхом побудови кількісних співвідношень «структура-дія», які можуть бути використані при оцінці властивостей сполук, зокрема, механізмів біологічної дії.