

Методом флуоресцентної спектроскопії встановлено, що у присутності координаційно ненасиченого комплексу **5b** інтенсивність флуоресценції ДНК значно зменшується. Цей ефект може бути зумовлений висолюванням молекули ДНК або її руйнуванням внаслідок взаємодії з даним комплексом. І навпаки, у присутності координаційно насиченого паладієвого комплексу **6b** спостерігається різке збільшення інтенсивності збудження та люмінесценції ДНК. При цьому з'являється ізобестична точка на спектрах поглинання. Це вказує на проходження хімічної взаємодії між молекулами ДНК та комплексу, а також свідчить про можливість інтеркаляції молекул **6b**, що характеризуються планарною структурою та невеликими розмірами, в подвійну спіраль ДНК. При додаванні до розчину ДНК комплексу **6c** інтенсивність його флуоресценції практично не змінюється, що свідчить про відсутність взаємодії між компонентами суміші через великі розміри молекули комплексу. Таким чином було синтезовано координаційну сполуку паладію з 2-(3-метил)-5-піридил-1,2,4-триазолом, що виступає ефективним інтеркалятором подвійної спіралі ДНК.

ИЗУЧЕНИЕ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНОЙ АКТИВНОСТИ НОВЫХ ПРОИЗВОДНЫХ АМИДОВ МАЛОНОВОЙ И ЩАВЕЛЕВОЙ КИСЛОТ

Вахнина Н.Г.

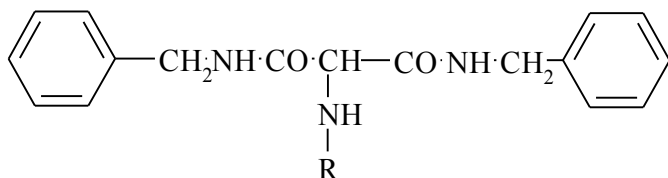
Колледж Национального фармацевтического университета, г. Харьков, Украина

natavaха@mail.ua

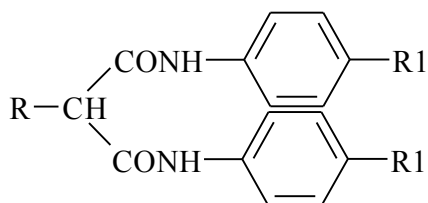
Актуальным направлением современной фармации является разработка и изучение новых нестероидных противовоспалительных средств (НПВС) с низкой токсичностью.

Объектом исследований стали новые 43 соединения - производные малоновой и щавелевой кислот, с заранее спрогнозированным противовоспалительным действием. Исследуемые вещества были синтезированы учеными НФаУ, под руководством проф. Безуглого П.А..

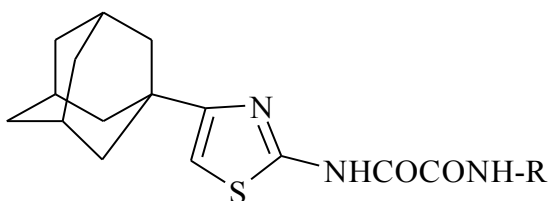
Структура исследуемых веществ



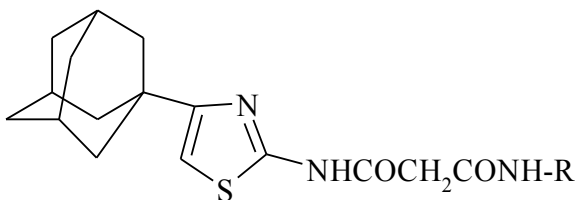
производные дибензиламида фениламиномалоновой кислоты (соединения 1-13)



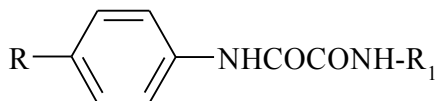
производные дизамещенных дианилидов малоновой кислоты (соединения 14-26)



производные 4-(адамантил-1)-тиазолил-2-амидов щавелевой кислоты (соединения 27-30)



производные 4-(адамантил-1)-тиазолил-2-амидов малоновой кислоты (соединения 31-36)



производные дизамещенных фениламидов щавелевой кислоты (соединения 37-43)

Целью данного исследования было изучение зависимости противовоспалительного действия от химической структуры в ряду исследуемых веществ.

Противовоспалительное действие изучали в условиях воспроизведения острого каррагенинового отека стопы у крыс. Острое каррагениновое воспаление характеризуется развитием значительной воспалительной реакции, которая на 4-ый час эксперимента верифицируется значительным отеком стопы у экспериментальных животных. Диапазон увеличения объема лапки колеблется от 1,28 до 1,68 условных единиц отека.

Исследуемые вещества вводили экспериментальным животным внутривентрально в дозе 1/20 ЛД₅₀. Препарат сравнения вольтарен (диклофенак натрия) вводили крысам

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: