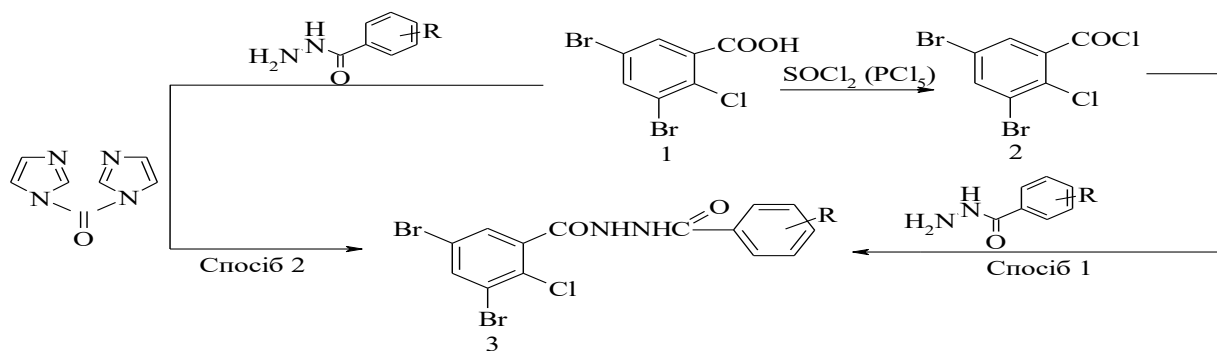
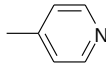


Тому, важливою задачею медичної та фармацевтичної хімії є пошук і створення більш ефективних протитуберкульозних засобів.

У зв'язку з вищевказаним, нами здійснено синтез гідразидів 3,5-дибром-2-хлорбензойної кислоти (3). Синтез гідразидів здійснено двома способами, а саме гідразинолізом хлорангідриду 3,5-дибром-2-хлорбензойної кислоти (2) (спосіб 1) і взаємодією 3,5-дибром-2-хлорбензойної кислоти (1) з гідразинами в присутності активатора карбоксильної групи карбонілдімідазолу (спосіб 2) (схема 1).

Схема 1



де, R= H, 4-CH₃, 4-OCH₃, 4-C₂H₅, 4-OC₂H₅, 4-Cl, 4-Br, 

З наведених реакцій синтезу, спосіб 2 являється більш практичним та дозволяє отримати цільові сполуки з більшим виходом.

Отримані гідразиди 3,5-дибром-2-хлорбензойної кислоти (3) являють собою кристалічні речовини білого кольору, добре розчинні в етанолі, діоксані, ДМФА, практично не розчинні у воді.

Будову синтезованих гідразидів (3) підтверджено даними елементного аналізу, ІЧ-, та ПМР-спектроскопією, а індивідуальність методом хроматографії в тонкому шарі сорбенту.

З метою оптимізації фармакологічних досліджень, синтезовані сполуки (3) були проаналізовані програмою PASS. Згідно даними комп'ютерного прогнозу спектру фармакологічної активності, всі сполуки мають високу ймовірність протитуберкульозної активності (0,56-0,82 Pa), особливо найбільше значення «Pa» мають сполуки, які містять фрагмент ізоніазиду, метокси-, та етокси-радикали, що узгоджується з літературними даними.

НЕЙРОЛЕПТИЧНА АКТИВНІСТЬ ПОХІДНИХ [2-(3-R-1H-1,2,4-ТРИАЗОЛ-5-ІЛ)ФЕНІЛ]АМІНІВ ТА ЇХ ПОХІДНИХ

І. М. Білай, Є. О. Михайлюк, К. П. Шабельник, С. І. Коваленко

Запорізький державний медичний університет

Створення препаратів нейрорептиків (антипсихотиків) в ХХ столітті стало великим проривом в психіатрії та психофармакології, що дозволило вперше розробити принципи і методи раціональної фармакотерапії шизофренії та інших форм психічної патології і призвело до суттєвих змін в лікуванні хворих на шизофренію: лікування більшості клінічних форм стало можливим у більшості в позалікарняних умовах, а утримання їх у психіатричних стаціонарах стало наближатися до загальномедичних норм.

Однак, незважаючи на тривале і досить успішне застосування традиційних (класичних) нейролептиків, обумовлене широким спектром їх дії, дана група препаратів має цілий ряд обмежень при використанні, і в першу чергу у зв'язку з частотою і виразністю побічних ефектів.

Метою роботи був пошук біологічно активних речовин з нейролептичною дією серед [2-(3-R-1H-1,2,4-триазол-5-іл)феніл]амінів та їх похідних.

Досліди проводилися на білих щурах лінії Вістар масою 170-200 г. Визначали вплив [2-(3-R-1H-1,2,4-триазол-5-іл)феніл]амінів та їх похідних і препарату порівняння трифтазину на тривалість сну викликаного дією етаміналу натрію в дозі 30 мг / кг. Брали до уваги час збереження бічного положення (в хвиликах) після внутрішньочеревного введення досліджуваних речовин.

Проведені дослідження показали, що [2-(3-R-1H-1,2,4-триазол-5-іл)феніл]аміни та їх похідні неоднозначно проявляли нейролептичну активність. Отже, 2-(3-циклогексил-1H-1,2,4-триазол-5-іл)анілін мав виражену нейролептичну дію і за силою цього ефекту не поступався препарату порівняння трифтазину та був рекомендований для подальших досліджень нейролептичної дії.

ПОШУК ПЕРСПЕКТИВНИХ ЛІКАРСЬКИХ СУБСТАНЦІЙ СЕРЕД ТІОСУЛЬФОЕСТЕРІВ З ХІНОЛІНОВИМ ТА ХІНОЛІНХІНОНИМ ФРАГМЕНТАМИ

**С. В. Василюк, Н. Я. Монька, Д. Б. Баранович, Г. М. Хоміцька, Г. Б. Шиян,
М. В. Вовк, В. І. Лубенець, В. П. Новіков**

*Національний університет „Львівська політехніка”,
vlubenets@gmail.com*

Хінолін і його похідні є важливим класом гетероциклічних сполук. Вони завжди привертали увагу як синтетичні реагенти та біологічні об'єкти через їх різноманітні хімічні і біологічні властивості. Серед похідних хіноліну знайдено сполуки, які проявляють бактерицидну, антипротозойну, амебоцидну, протизапальну активності. Значний інтерес, у зв'язку з високим індексом їх біологічної активності, привертають до себе й похідні 5,8-хінолінхінону. Відомо, що 6-аніліно-5,8-хінолінхінон і його похідні є перспективними сполуками для запобігання пухлинному росту. Так, *Дінеміцин А* і *Streptonigrin* використовуються як протипухлинні антибіотики, в тому числі й для лікування злоякісних пухлин, включаючи лімфоми, меланоми, рак молочної залози, тощо. На додаток до антипухлинної дії стрептонігрин проявляє широкий спектр антибактеріальної активності, а також проявляє протівірусну активність *in vitro* та *in vivo*.

Цікавими в хімічному і прикладному аспектах є поєднання в одній структурі тіосульфатної групи та хінолінового фрагменту. Серед тіосульфоестерів з хіноліновим фрагментом синтезованих на кафедрі технології біологічно активних сполук фармацевтичної та біотехнології Національного університету «Львівська політехніка» виявлені речовини, які мають чітко виражену: бактерицидну активність – S-метил- і S-етил-8-хінолінтіосульфонати; фунгіцидну активність – S-