

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

СУЧАСНІ АСПЕКТИ СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

Тези доповідей Міжнародної науково-практичної
дистанційної конференції, присвяченої
100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ

16 квітня 2021 року
м. Харків

Харків
НФаУ
2021

УДК 615.014(043.2)

С 89

Редакційна колегія:

проф. А. А. Котвіцька, проф. А. І. Федосов, проф. І. М. Владимірова,
проф. С. В. Колісник, проф. І. С. Гриценко

Сучасні аспекти створення лікарських засобів : тези допов.

С 89 Міжнар. наук.-практ. дистанц. конф., присвяченої 100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ (16 квітня 2021 р.). – Х. : НФаУ, 2021. – 224 с.

Збірка містить матеріали Міжнародної науково-практичної дистанційної конференції «Сучасні аспекти створення лікарських засобів» (16 квітня 2021 р.) за науковими напрямками: конструювання, синтез і модифікація біологічно активних сполук, дослідження зв'язку структура – активність, методи фармакологічного скринінгу; сучасні підходи до створення нових лікарських та косметичних засобів, функціональних харчових та дієтичних добавок; аналітичні аспекти у синтезі біологічно активних сполук та створенні нових лікарських засобів; контроль якості лікарської рослинної сировини, фітопрепаратів, парфумерно-косметичних засобів та функціональних харчових добавок; сучасний фармацевтичний аналіз та стандартизація ліків; хіміко-токсикологічний аналіз біологічно активних речовин та лікарських засобів.

Для широкого кола науковців та практичних працівників фармації і медицини.

Матеріали подаються мовою оригіналу. За достовірність опублікованих результатів повну відповідальність несуть автори.

УДК 615.014(043.2)

ДОСЛІДЖЕННЯ АНТИЕКСУДАТИВНОЇ АКТИВНОСТІ КОМПОЗИЦІЇ N-(3,4-ДИМЕТОКСИФЕНІЛ)-2-[4-АМІНО-5-(ПІРИДИН-4-ІЛ)-4Н-1,2,4- ТРІАЗОЛ-3-ІЛТІО]АЦЕТАМІДУ З 1,3,7-ТРИМЕТИЛКСАНТИНОМ

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

¹*Харківський національний медичний університет, м. Харків, Україна*

²*Ніжинський державний університет ім. Миколи Гоголя"*

м. Ніжин, Україна

nm.chalenko@knmu.edu.ua

Запалення – це природна реакція організму на зовнішній вплив (травми, мікробне обсіменіння, термічні або хімічні подразники). Ознаками запалення є біль, гіперемія, гіпертермія, набряк і порушення функції органів та тканин. Запалення є найбільш поширеним патологічним процесом. Немає жодного напрямку медицини, який би не був пов'язаний з профілактикою, діагностикою і лікуванням запальних процесів, а нестероїдні протизапальні засоби (НПЗЗ), які мають виражену антиексудативну (АеА), аналгетичну, жарознижувальну дію широко використовують для лікування запальних захворювань, але мають низку обмежень, пов'язаних з їх побічною дією. Тому пошук нових потенційних НПЗЗ є актуальною проблемою сучасної медицини та фармації.

За останні роки приділяється багато уваги хімії 1,2,4-тріазолу та його конденсованим похідним. Перспективність даної гетероциклічної системи обумовлена високою реакційною здатністю, низькою токсичністю, доступністю реактивів для синтезу, широким спектром біологічної активності. Нами було синтезовано ряд похідних 4-аміно-5-(піридин-4-іл)-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-тріазол-3-тіона як потенційних НПЗЗ, проведено їх фармакологічний скринінг щодо АеА. Серед похідних 4-аміно-5-(піридин-4-іл)-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-тріазол-3-тіона виділено сполуки-лідери за АеА. Відомо, що комбінація кількох активних фармацевтичних компонентів в одному лікарському засобі сприяє розширенню спектра його специфічної дії і, що 1,3,7-триметилксантин (кофеїн) здатний потенціювати протибольовий, протизапальний та інші ефекти лікарських засобів, тому метою нашого дослідження було створення фармацевтичної композиції з синтезованого нами раніше, N-(3,4-диметоксифеніл)-2-[4-аміно-5-(піридин-4-іл)-4Н-1,2,4-тріазол-3-ілтїо]-ацетаміду (сполука 1) і кофеїну та встановлення її АеА.

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 моделювали за допомогою субплантарного введення у задню лапу 0,1 мл 2% розчину формаліну. Об'єм лапи вимірювали за допомогою цифрового плетизмометра (ІІТС Life Science (США)) до введення препаратів та через 4 години після моделюючої ін'єкції формаліну. Досліджувані речовини вводили однократно перорально у вигляді завису на 3% крохмальному слизу за 1 годину до максимального розвитку набряку. Тварини 1-ї групи були контролем, їм однократно перорально внутрішньошлунково вводили 3 % крохмальний слиз (2 мл на 200 г ваги тіла тварини) за 1 годину до розвитку максимального набряку. Аналогічно вводили сполуку 1, кофеїн, їх композицію

та референс-препарат. Щурам: 2-ї групи вводили сполуку 1 в дозі 10 мг на 1 кг ваги тварини; 3-ї групи – кофеїн з розрахунку 0,6 мг на 1 кг ваги тварини. Щурам 4-ї групи – композицію сполуки 1 (10 мг на 1 кг ваги тварини) з кофеїном (0,6 мг на 1 кг ваги тварини). Щурам 5-ї групи – референс-препарат диклофенак натрію з розрахунку 8 мг на 1 кг ваги тварини.

Результати вивчення АєА речовин показали, що сполука 1 має високу АєА – 79,63%, що значно перевищує АєА препарату порівняння диклофенак натрію (44%). АєА кофеїну склала 18,33%, а активність фармацевтичної композиції сполуки 1 з кофеїном – 83,3%, що свідчить про потенціювання кофеїном АєА сполуки 1.

Таким чином, експериментальні дослідження на лабораторних щурах показали, що композиція *N*-(3,4-метоксифеніл)-2-[4-аміно-5-(піридин-4-іл)-4*H*-1,2,4-тріазол-3-ілтіо]ацетаміду з кофеїном є доцільною відносно АєА і перспективною для подальшого вивчення на аналгетичну дію.

- ОДЕРЖАННЯ СОЛЮБІЛІЗАТІВ НА ОСНОВІ
ДИТІОКАРБАМАТНИХ ПОХІДНИХ 9,10-АНТРАЦЕНДІОНУ 180**
СТАСЕВИЧ М.В., ЗВАРИЧ В.І., ЗАЯРНЮК Н.Л.
- ДОКІНГОВІ ДОСЛІДЖЕННЯ ПОХІДНИХ ІМІДАЗО-АЗЕПІНІО
З АНТИФУНГАЛЬНОЮ АКТИВНІСТЮ 181**
СУВОРОВА З.С., СЕРЕДЕНКО О.В., БОБКОВА Л.С., ДЕМЧЕНКО С.А.
- ПОШУК НОВИХ ДИПОЛЯРОФІЛІВ ДЛЯ РЕАКЦІЇ
1,3-ДИПОЛЯРНОГО ЦИКЛОПРИЄДНАННЯ СЕРЕД
ПРОГНОЗОВАНИХ ФАРМАКОФОРІВ
ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ІНФЕКЦІЇ COVID-19 183**
СЮМКА Є.І., СИТНИК К.М., ШЕМЧУК Л.А., ЧЕРНИХ В.П.
- ДОСЛІДЖЕННЯ АКТИВНОСТІ ЗВ'ЯЗУВАННЯ ВІЛЬНИХ
РАДИКАЛІВ N'-ГЕТАРИЛІДЕН-2-ОКСО-3,3-ДИФЕНІЛ-
2,3-ДИГІДРО-1H-ТІЄНО[3,4-b] ПРОЛ-6-КАРБОГІДРАЗІДІВ 184**
ТКАЧОВА Ю.О., БЕВЗ Н.Ю., ГАРНА Н.В., СИТНИК К.М.,
СЮМКА Є.І., КОЛІСНИК С.В.
- ВИЯВЛЕННЯ КЛОЗАПІНУ У ВНУТРІШНІХ ОРГАНАХ 186**
ТУРЕВИЧ Ю.І., БІДНИЧЕНКО Ю.І.
- РАЗРАБОТКА И СТАНДАРТИЗАЦИЯ ШИПУЧИХ ГРАНУЛ
С ПЕКТИНОВЫМИ ВЕЩЕСТВАМИ ИЗ ТРАВЫ АНИСА
ОБЫКНОВЕННОГО 188**
УМАРОВ У.А., ЗДОРИК А.А., КОЛЕСНИК Е.В.
- ДОСЛІДЖЕННЯ КВІТОК МАКУ
ДИКОГО МЕТОДОМ СПЕКТРОСКОПІЇ ВІДБИТТЯ 189**
ФЕДЕНКО В.С.
- ДЕЯКІ ОСОБЛИВОСТІ СИНТЕЗУ НОВИХ
5-(ТІОФЕН-3-ІЛМЕТИЛ)-4R-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ТІОЛІВ 190**
ХІЛЬКОВЕЦЬ А.В.
- СИНТЕЗ ГІДРАЗОНІВ ТА ЕСТЕРІВ
НА ОСНОВІ ТЕРПЕНОЇДІВ ТА ВАЛЬПРОЄВОЇ КИСЛОТИ 191**
ХОДНЕВИЧ Д.О., НЕСТЕРКІНА М.В.
- ДОСЛІДЖЕННЯ АНТИЕКСУДАТИВНОЇ АКТИВНОСТІ
КОМПОЗИЦІЇ N-(3,4-ДИМЕТОКСИФЕНІЛ)-2-[4-АМІНО-
5-(ПІРИДИН-4-ІЛ)-4H-1,2,4-ТРИАЗОЛ-3-ІЛТІО]АЦЕТАМІДУ
З 1,3,7-ТРИМЕТИЛКСАНТИНОМ 192**
ЧАЛЕНКО Н.М., ДЕМЧЕНКО А.М., СИРОВА Г.О.
- ДОСЛІДЖЕННЯ ФАРМАКО-ТЕХНОЛОГІЧНИХ
ХАРАКТЕРИСТИК СУБСТАНЦІЇ КАТІАЗИН 194**
ЧЕРНЯЄВА О.І., ГРИЦЕНКО І.С., ПАЩЕНКО Ю.Г.

СУЧАСНІ АСПЕКТИ СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

Тези доповідей Міжнародної науково-практичної
дистанційної конференції, присвяченої
100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ

16 квітня 2021 року
м. Харків

Формат 60 × 84/16. Ум. друк. арк. 25. Тираж 50 пр.

Національний фармацевтичний університет
вул. Пушкінська, 53, м. Харків, 61002
Свідоцтво суб'єкта видавничої справи серії ДК № 3420 від 11.03.2009.



СУЧАСНІ АСПЕКТИ СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

*Тези доповідей Міжнародної науково-практичної
дистанційної конференції, присвяченої
100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ*

16 квітня 2021 р., м. Харків