

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я  
ТЕРНОПІЛЬСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ  
імені І.Я. ГОРБАЧЕВСЬКОГО**

**НАУКОВО-ТЕХНІЧНИЙ ПРОГРЕС І  
ОПТИМІЗАЦІЯ ТЕХНОЛОГІЧНИХ ПРОЦЕСІВ  
СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ПРЕПАРАТІВ**

**Матеріали 4-ї науково-практичної конференції з міжнародною участю**

**29-30 вересня 2011 року**

**Тернопіль ТДМУ  
“Укрмедкнига”  
2011**

---

**МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я  
ТЕРНОПІЛЬСЬКИЙ ДЕРЖАВНИЙ МЕДИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ  
імені І.Я. ГОРБАЧЕВСЬКОГО**

**НАУКОВО-ТЕХНІЧНИЙ ПРОГРЕС І  
ОПТИМІЗАЦІЯ ТЕХНОЛОГІЧНИХ ПРОЦЕСІВ  
СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ПРЕПАРАТІВ**

**Матеріали 4-ї науково-практичної конференції з міжнародною участю**

**29-30 вересня 2011 року**

**Тернопіль ТДМУ  
“Укрмедкнига”  
2011**

---

## ЗМІСТ

### Розділ 1. ОПТИМІЗАЦІЯ ТЕХНОЛОГІЧНИХ ПОЦЕСІВ ПОШУКУ І СВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ (СИНТЕЗ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ СПЛУК)

<i>Черних В.П.</i> Нанотехнології: реалії та перспективи	3
<i>Алтухов О.О., Колісник С.В., Болотов В.В., Штриголь С.Ю., Шатілов О.В.</i> Синтез, властивості і біологічна активність <i>n</i> -[2-(бензоїламіно)(2-оксо-1,2-дигідро-3 $\alpha$ -індол-3-іліден)ацетил] амінокислот та їх естерів	3
<i>Вельчинська О.В., Вільчинська В.В.</i> Нові фосфоромісні сукциніміди з потенційною біологічною активністю	5
<i>Вільчинська В.В., Вельчинська О.В.</i> Протипухлинна активність біс-аддукту 5-метилурацилу	5
<i>Вельчинська О.В., Ніженковська І.В., Ніженковський О.І., Вільчинська В.В.</i> Пошук нових біологічно активних сполук серед похідних 2-меркаптоаніліну	6
<i>Вознюк О.В., Гаврилюк Д.Я., Лесик Р.Б.</i> Синтез нових неконденсованих похідних з піразоліновим та бензоксазоліновим фрагментами в молекулах	6
<i>Гаврилюк Д.Я., Зіменковський Б.С., Лесик Р.Б.</i> Синтез та вивчення біологічної активності 5-піразолінзаміщених 4-тіазолідінонів	7
<i>Голос І.Я., Кленіна О.В., Цепелевські Г.О.</i> Використання квантово-хімічних дескрипторів для прогнозування гіпоглікемічної активності $\epsilon$ -карбоксіпентиламідів 4- <i>n</i> - <i>r</i> -сульфамідооксанілових кислот	8
<i>Зеліско Н.І., Лесик Р.Б.</i> Синтез нових похідних тіопірано[2,3- <i>d</i> ]тіазол-6-карбонової кислоти	9
<i>Кленіна О.В., Голос І.Я., Цепелевські Г.О.</i> Використання 3D молекулярних дескрипторів для прогнозування анальгетичної активності похідних $\epsilon$ -карбоксіпентиламідів <i>r</i> -бензолсульфонілоксамінових кислот	9
<i>Коваленко С.І., Антипенко Л.М., Білий А.К., Скорина Д.Ю., Посилкіна Ю.Ю., Берест Г.Г., Антипенко О.М., Носуленко І.С., Шабельник К.П., Воскобойнік О.Ю., Кривошей О.В., Карпенко О.В., Нікітін В.О.</i> Дослідження протипухлинних властивостей у ряду заміщених хіназоліну	10
<i>Колесніков О.В., Демченко А.М.</i> Пошук нових протівірусних сполук серед нітрогенвмісних гетероциклів	11
<i>Коробко Д.Б., Колесник О.О.</i> Дослідження реакційної здатності 7-арилалкіл-8-гідразинотеофілінів	13
<i>Крицишин А.П., Драпак І.В., Огурцов В.В., Лесик Р.Б., Зіменковський Б.С.</i> Використання <i>in silico</i> підходів в дослідженні поліциклічних тіопірано[2,3- <i>d</i> ]тіазолів як потенційних протиракових агентів	14
<i>Лелюх М.І., Гаврилюк Д.Я., Зіменковський Б.С., Лесик Р.Б.</i> Дослідження протипухлинної активності нових неконденсованих похідних тіазолідіоніону-2,4 з 1,3,4-оксадіазольним фрагментом в молекулах	15
<i>Мосула Л.М., Гаврилюк Д.Я., Грабоус О.М., Лесик Р.Б.</i> Синтез 5-заміщених роданнів з бензтіазольним фрагментом в 3 положенні як потенційних протитуберкульозних агентів	16
<i>Перехода Л.О., Георгіянци В.А.</i> Синтез та фізико-хімічні властивості амідів 5-(4-хлор)феніл-1,3,4-оксадіазол-2-іл тіоацетатної кислоти	16
<i>Петрушка Б.М., Тулайдан Г.М., Покришко О.В., Климнюк С.І., Барановський В.С., Грищук Б.Д.</i> Антимікробна активність 2-хлоро(тіоціанато)-2-бензилбутандіових кислот	17
<i>Прийменко А.О., Александрова К.В., Васильєв Д.А., Шкода О.С., Казунін М.С., Кандибей К.І.</i> Синтез, фізико-хімічні та біологічні властивості 7- <i>n</i> та 7- <i>r</i> -8-амінометил-3-метил-1 <i>n</i> -пурин-2,6-(3 <i>n</i> ,7 <i>n</i> )-діонів	18

Встановлено, що біс-похідне **I** є малотоксичним (ЛД<sub>50</sub> 515 мг/кг). При використанні пухлини головного мозку людини (операційний та біопсійний матеріал) в підкапсульному тесті за методом Богдана зареєстровано виражений протипухлинний ефект біс-похідного **I** з відсотком гальмування 29,8 % (критерій значущості  $\geq 25,0$  % гальмування пухлинного росту).

Висновки. Біс-похідне 5-метилурацилу з вираженим протипухлинним ефектом може бути перспективним для подальшого вивчення.

## ПОШУК НОВИХ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ СПОЛУК СЕРЕД ПОХІДНИХ 2-МЕРКАПТОАНІЛІНУ

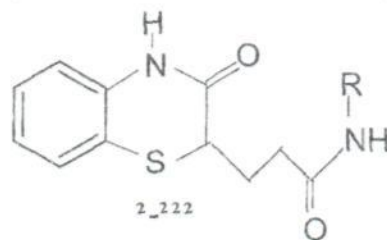
*О.В. Вельчинська, І.В. Ніженковська, О.І. Ніженковський, В.В. Вільчинська*

Національний медичний університет імені О.О. Богомольця

[elena\\_wwu@ukr.net](mailto:elena_wwu@ukr.net)

Робота присвячена синтезу нових біологічно активних сукцинімідів на основі N-заміщених малеїнімідів та 2-меркаптоаніліну у якості сіркувмісного синтону, дослідженню їх токсичності і біологічної активності.

Мета роботи. Мета полягає в хімічній модифікації молекул малеїнімідів з подальшим вивченням біологічної активності їх нових похідних, а саме: після конструювання потенційно активних структур розроблено нові препаративні методи синтезу оригінальних сукцинімідів з фрагментом молекули 2-меркаптобензойної кислоти. Шляхом взаємодії 2-меркаптоаніліну з N-заміщеними малеїнімідами синтезовано оригінальні N-заміщені сукциніміди **I-III** загальної формули:



де R = -*m*-CF<sub>3</sub>Ph (**I**), -*p*-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Ph (**II**), -*o*-ClPh (**III**)

Експерименти щодо визначення гострої токсичності та протисудомної активності (білі нелінійні миші-самці вагою 22,0±2,0 г) показали, що сполуки **I-III** малотоксичні (ЛД<sub>50</sub> у інтервалі від 2000-2025 мг/кг) та не проявляють протисудомної активності. Однак, під час проведення біологічного скринінгу для сполук **I, II** виявлено бактерійну та фунгіцидну види активності.

Висновки. Фармакофоромісні сполуки **I-III** можуть бути перспективними як потенційно біологічно активні для поглибленого вивчення їх фізіологічних властивостей.

## СИНТЕЗ НОВИХ НЕКОНДЕНСОВАНИХ ПОХІДНИХ З ПІРАЗОЛІНОВИМ ТА БЕНЗОКСАЗОЛЬНИМ ФРАГМЕНТАМИ В МОЛЕКУЛАХ

*О.В. Вознюк, Д.Я. Гаврилюк, Р.Б. Лесик*

Львівський національний медичний університет імені Данила Галицького

[dr\\_r\\_lesyk@org.lviv.net](mailto:dr_r_lesyk@org.lviv.net)

Синтез нових систем, що поєднують піразоліновий та споріднені гетеро цикли, є обґрунтованим напрямком пошуку нових високоактивних сполук, адже похідні піразолінів характеризуються широким спектром біологічної активності, зокрема протипухлинною, антипаразитарною, противірусною дією, тощо. На нашу думку, перспективним є поєднання в одній молекулі піразолінового та бензоксазольного