

**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**

---

## НОВІ ФОСФОРОВМІСНІ СУКЦИНІМІДИ З ПОТЕНЦІЙНОЮ БІОЛОГІЧНОЮ АКТИВНІСТЮ

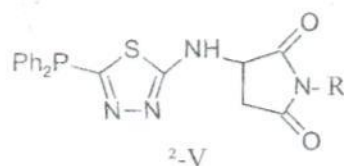
*О.В. Вельчинська, В.В. Вільчинська*

*Національний медичний університет імені О.О. Богомольця*

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

Робота присвячена синтезу нових потенційно біологічно активних сукцинімідів на основі малеїнімідів та фосфорильованих аміногіадиазолів у якості фосфоровмісних синтонів. Сукциніміди є сполуками з анксиолітичним типом дії, психотропні агенти, протисудомні засоби.

Мета роботи. З метою отримання нових біологічно активних сукцинімідів нами була досліджена реакційна здатність N-заміщених малеїнімідів вступати в реакції з фосфорильованим аміногіадиазолом. Шляхом взаємодії малеїнімідів з аміногіадиазолом синтезовано фосфорильовані N-заміщені сукциніміди I-V загальної формули:



де R = -*o*-ClPh (I), -*p*-ClPh (II), -*o*-BrPh (III), -*p*-BrPh (IV), -*p*-FPh (V)

Реакції проводилися у системі розчинників (бензол-піридин) при температурі 60-80 °C та перемішуванні 4-7 годин. Експерименти щодо визначення гострої токсичності та протисудомної активності (білі нелінійні миші-самці вагою 22,0±2,0 г) показали, що сполуки I-V малотоксичні (LD<sub>50</sub> у інтервалі від 650-560 мг/кг) та потенціюють судомну дію коразолу, викликаючи кровотечі у піддослідних тварин.

Висновки. Однак, фармакофоровмісні сполуки I-V можуть бути перспективними як потенційно біологічно активні для подальшого вивчення їх фізіологічних властивостей.

## ПРОТИПУХЛИННА АКТИВНІСТЬ БІС-АДДУКТУ 5-МЕТИЛУРАЦИЛУ

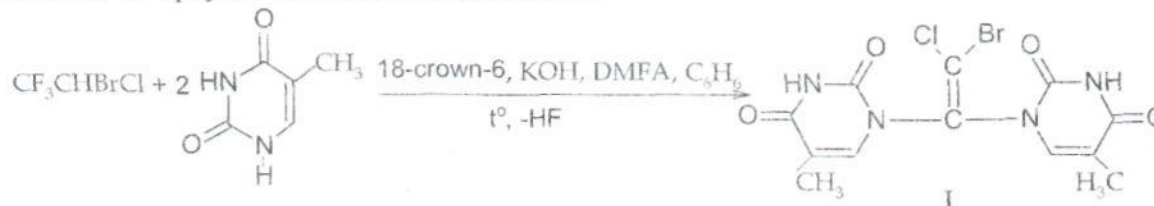
*В.В. Вільчинська, О.В. Вельчинська*

*Національний медичний університет імені О.О. Богомольця*

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

Вступ. На сьогоднішній день цілком закономірними є пошуки шляхів елімінації пухлинних клітин із множинною лікарською стійкістю за допомогою різних механізмів. Робота присвячена синтезу біс-аддукту 5-метилурацилу на основі 5-метилурацилу і фторотану (молярне співвідношення 2:1) та дослідженню його протираковинної активності.

Мета роботи. З метою отримання нових сполук з протираковинною активністю нами була досліджена реакційна здатність 5-метилурацилу вступати в реакцію з фторотаном. За новим препаративним методом реакцією 5-метилурацилу з фторотаном (1,1,1-трифтор-2-бром-2-хлоретаном) синтезовано біс-аддукт I. Реакцію проведено при каталізі 18-краун-6-комплексом за схемою:





## 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-тіазолідинонів	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>Крищшин 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 тіазолідиндіону-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