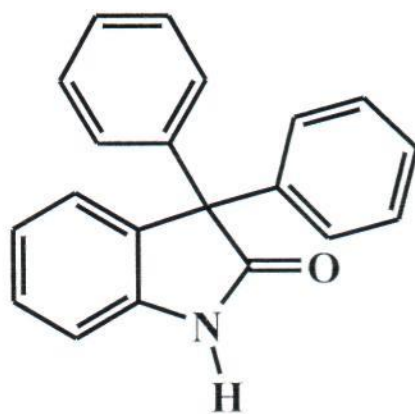




# ПРОБЛЕМИ СИНТЕЗУ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН ТА СТВОРЕННЯ НА ЇХ ОСНОВІ ЛІКАРСЬКИХ СУБСТАНЦІЙ

*Матеріали Української  
науково-практичної конференції,  
присвяченої пам'яті  
доктора хімічних наук, професора  
Павла Олексійовича Петюніна  
(до 95-річчя з дня народження)*



26 лютого 2009 року  
м. Харків

<b>СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ АРИЛАМИДОВ АМИНОКАРБОНОВЫХ КИСЛОТ .....</b>	<b>46</b>
О.В. Гашкова, В.И. Панцуркин, И.П. Рудакова, Б.Я. Сыропятов, М.И. Вахрин	
<b>ХІМІЧНІ ПЕРЕТВОРЕННЯ БІОЛОГІЧНО АКТИВНИХ 1-R-4-R<sup>1</sup>-5- АМІНО-1,2,3-ТРИАЗОЛІВ(1Н).....</b>	<b>47</b>
В.А.Георгіянець, Л.О.Перехода, С.В.Плис, А.В.Глуценко	
<b>ЦІЛЕСПРЯМОВАНИЙ СИНТЕЗ НОВИХ ПОТЕНЦІЙНИХ АНТИКОНВУЛЬСАНТІВ В РЯДУ ПОХІДНИХ 2-ФЕНІЛ- 5-МЕРКАПТО-1,3,4-ОКСАДІАЗОЛУ .....</b>	<b>48</b>
В.А.Георгіянець, А.М.Демченко, Л.О.Перехода, Г.І.Гашко, К.С.Рядних	
<b>ДОБУВАННЯ НОВОГО АНТИДЕПРЕСАНТА ТІАНЕПТИНУ ТА ЙОГО КІЛЬКІСНЕ ВИЗНАЧЕННЯ. ....</b>	<b>49</b>
Н.В. Гончарук, І.Й. Галькевич	
<b>СИНТЕЗ НОВИХ ПОХІДНИХ 1,1-ДІОКСО-4Н-1,4-БЕНЗОТІАЗИНІВ.....</b>	<b>50</b>
ГРЕВЦОВ О.Ю., БОНДАРЕНКО А.Б., ЗАРЕМБА О.В., КОВАЛЕНКО С.М., ЧЕРНИХ В.П.	
<b>СИНТЕЗ И БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ ПИРАЗИН-2-ИЛ- АМИДОВ 1R-4-ГИДРОКСИ-2-ОКСО-1,2-ДИГИДРОХИНОЛИН-3- КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ .....</b>	<b>51</b>
Л.А. Гриневич, И.В. Украинец, О.В. Бевз	
<b>ВАЛІДАЦІЯ КІЛЬКІСНОГО ВИЗНАЧЕННЯ ФЕРМЕНТНОЇ ІНГІБУЮЧОЇ АКТИВНОСТІ АПРОТИНІНУ .....</b>	<b>52</b>
О.І. Гризодуб, Д.А. Леонтєв, Н.В. Денисенко, Л.А. Січкач	
<b>НОВІ ФОСФОРВМІСТКІ СУКЦИНІМІДИ. СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ БІОЛОГІЧНОЇ АКТИВНОСТІ.....</b>	<b>53</b>
Ю.І. Губський, О.В. Вельчинська	
<b>СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ БІОЛОГІЧНОЇ АКТИВНОСТІ НОВИХ ПОХІДНИХ 2-МЕРКАПТОБЕНЗОЙНОЇ КИСЛОТИ .....</b>	<b>55</b>
Ю.І. Губський, О.В. Вельчинська, Л.А. Бутко, А.Б. Драпайло	
<b>НОВІ БІОЛОГІЧНО АКТИВНІ ПОХІДНІ 2-МЕРКАПТОАНІЛІНУ .....</b>	<b>56</b>
Ю.І. Губський, О.В. Вельчинська, В.В. Вільчинська, А.Б. Драпайло	
<b>СИНТЕЗ НОВИХ НЕКОНДЕНСОВАНИХ СИСТЕМ З 4- ТІАЗОЛІДОНОВИМ ТА 2-(3,5-ДИФЕНІЛ-4,5-ДИГІДРОПІРАЗОЛ-1-ІЛ)-2- ОКСОЕТИЛЬНИМ ФРАГМЕНТАМИ В МОЛЕКУЛАХ.....</b>	<b>57</b>
Д.Я. Гаврилюк, І.О. Степаненко, Р.Б. Лесик	
<b>ЗАМІЩЕНІ 3,5-ДИБРОМ-2-[3-(R-ФЕНІЛ)АКРИЛОЇЛАМІНО]- БЕНЗОЙНИХ КИСЛОТ, ЇХ СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ ..</b>	<b>58</b>
С.Г.Ісаєв, Г.П.Жегунова, О.А.Близнюк, О.Л.Чикіна, Л.І.Боряк	

## НОВІ БІОЛОГІЧНО АКТИВНІ ПОХІДНІ 2-МЕРКАПТОАНІЛІНУ

Ю.І. Губський, О.В. Вельчинська, В.В. Вільчинська, А.Б. Драпайло<sup>1</sup>

Державний медичний університет ім. О.О. Богомольця

Україна, 01601, Київ-1, бульв.Т.Шевченка, 13

E-mail: [наука@mnu.edu.ua](mailto:наука@mnu.edu.ua)

Інститут органічної хімії НАН України

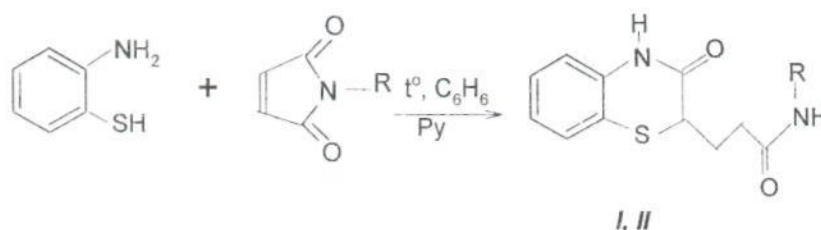
Україна, 02094, Київ-94, вул.Мурманська, 5

E-mail: [ioch@bpci.kiev.ua](mailto:ioch@bpci.kiev.ua)

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

Шляхом взаємодії 2-меркаптоаніліну з N-заміщеними малеїнімідами у молярному співвідношенні 1:1 синтезовано оригінальні N-заміщені сукциніміди I, II. Реакції проводилися у системі розчинників (бензол–піридин) при температурі 60-80 °С та перемішуванні реакційної суміші 1-5 годин з обробкою продуктів реакції розчином етилового спирту у воді (1:1) та безводним бензолом, фільтруванням, сушкою у вакуумі водострумного насосу, (схема 1).

Схема 1.



де, R = - meta-CF<sub>3</sub>Ph (I), -para-N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Ph (II)

Для визначення середньотоксичної дози ЛД<sub>50</sub> синтезованих сполук використовували експрес-метод В.Б. Прозоровського [1]. Критерієм оцінки токсичності сполук I, II вважався відсоток загибелі лабораторних тварин. Дослідження проводили на білих нелінійних мишах-самцях вагою 22,0±2,0 г; шлях введення – підшкірний. Експерименти показали, що сполуки I, II відносяться до малотоксичних сполук, ЛД<sub>50</sub> їхнє становить 2000 мг/кг, 2025 мг/кг, відповідно. При дослідженні протисудомної активності сполук I, II критерієм оцінки вважався відсоток гальмування судомних ефектів у лабораторних тварин після введення коразолу. Сполуки I, II розчиняли у фізіологічному розчині, вводилася одноразово, підшкірно, за 30 хвилин до введення коразолу. Сполуки I, II не проявляють даний вид активності та вираженого потенціюючого ефекту на судомну дію коразолу.

Під час проведення біологічного скринінгу для сполук I, II виявлено бактерійну та фунгіцидну види активності.

1. Прозоровский В.Б., Прозоровский В.П., Демченко В.М. Экспресс метод определения средней эффективности дозы и ее ошибки // Фармакол. та токсикол. – 1978. – Т. 41, № 4. – С. 407-509.