



Паламар А. О., Черноус В. О.*, Грозав А. М.*, Яремій І. М.**
ФАРМАКОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ АЗОЛІВ, ФУНКЦІОНАЛІЗОВАНИХ ЗАЛИШКОМ ТІОЦТОВОЇ КИСЛОТИ

Кафедра фармації

*Кафедра медичної та фармацевтичної хімії**

*Кафедра біоорганічної і біологічної хімії та клінічної біохімії***

Вищий державний навчальний заклад України

«Буковинський державний медичний університет»

П'ятичленні нітрогеновісмі гетероцикли відзначаються різноманітністю фармакологічної дії та є основою багатьох лікарських засобів. Серед них на особливу увагу заслуговують препарати з бактерицидною, фунгіцидною, антипротозойною (флуконазол, ітраконазол, вориконазол, метронідазол, клотримазол), антигіпертензивною (дибазол, лозартан), анальгетичною (анальгін та феназон) та гепатопротекторною активністю (тіотриазолін). Широкий спектр біологічної дії азолів став передумовою для отримання на їх основі різноманітних азоловмісних систем, що, у свою чергу, привело до виявлення серед них ряду нових типів активності. Огляд літературних джерел показав, що похідні азолів, функціоналізовані залишком тіоцтової кислоти проявляють виражені антиоксидантні, гіпоглікемічні, протимікробні, антигіпертензивні, протиподагричні та гіпохолестеринемічні властивості.

Для нормалізації основних функцій організму при захворюваннях шлунково-кишкового тракту, серцево-судинної, дихальної та нервової систем у складі комплексної фармакотерапії широко застосовують лікарські препарати з антиоксидантною активністю. З цією метою було створено вітчизняний лікарський препарат – тіотриазолін. Історія препарату починається з 60-х років минулого століття. Тоді під керівництвом професора Мазура І. А. на кафедрі фармацевтичної хімії Запорізького державного медичного університету вівся цілеспрямований пошук нових біологічно активних речовин. У результаті було синтезовано більш ніж 10 тисяч нових сполук, і в 1986 році, як потенційний лікарський засіб, було відібрано речовину Е-8252, яка в майбутньому отримала назву «Тіотриазолін». На сьогодні він є ефективним засобом для лікування хронічних гепатитів різної етіології, цирозу печінки, жовчокам'яної хвороби, ішемічної хвороби серця, інфаркту міокарда, стенокардії напруги та спокою, сприяє швидкому купіруванню основних клінічних проявів цих захворювань. Терапевтичний ефект тіотриазоліну зумовлений антиоксидантними, протиішемічними, мембраностабілізуючими, антиаритмічними, протизапальними, протівірусними та імунотропними властивостями. Він є класичним антиоксидантом, ефект якого пов'язаний із наявністю в його структурі сульфідної групи, яка забезпечує високий відновний потенціал. Окрім цього, наявність залишку оцтової кислоти в ролі замісника, зв'язаного із атомом сульфуру в п'ятому положенні, обумовлює протиішемічні властивості препарату.

Популярним методом створення нових лікарських засобів є модифікація відомих препаратів та їх структурних аналогів фармакофорними угрупованнями з метою посилення біологічної дії або забезпечення комплексного впливу комбінованого препарату на субстрат. Саме завдяки такому підходу синтезовано нову сполуку – лізіній-3-метил-1,2,4-триазоліл-5-тіоцтової кислоти («Ангіолін»), яка містить структурні фрагменти тіотриазоліну та L-лізину. У дослідженнях *in vitro* та *in vivo* продемонстровано здатність ангіоліну проявляти антиоксидантну, енерготропну, мітопротективну, ендотеліотропну, протиішемічну, кардіопротекторну, нейропротекторну та протизапальну активність.

Таким чином, систематизовано літературні дані щодо антиоксидантної активності азолів, функціоналізованих фрагментом тіоцтової кислоти. Встановлено, що такі азоловмісні сполуки є перспективними хімічними субстанціями в плані пошуку нових фармакологічно активних речовин та створення на їх основі високоефективних лікарських препаратів.

Петрюк А. Є.

ВПЛИВ БАЗАЛЬТОВОГО ТУФУ НА ФУНКЦІЮ НИРОК ЗА УМОВ ХРОНІЧНОГО ВВЕДЕННЯ

Кафедра фармакології

Вищий державний навчальний заклад України

«Буковинський державний медичний університет»

Відомо, що природні алюмосилікати – базальтові туфи володіють іонообмінними властивостями і здатні сорбувати різні за природою речовини. Це дозволяє спрогнозувати використання їх у медицині, як ентеросорбентів та основи для іммобілізації ферментів, токсинів, ліків. Беручи до уваги доступність вітчизняного природного мінералу – цеолітового базальтового туфу, становлять інтерес вивчення його впливу на водно-електролітний обмін та функцію нирок.

Досліди проведено на 12 статевозрілих лабораторних білих щурах масою 150-180 г. Тварин утримували на гіпонатрієвому режимі харчування з вільним доступом до води. Препарати вводили в один і той самий час доби впродовж 3 місяців в об'ємі 5 мг/кг маси тіла. Через 30 хв. після останнього введення в усіх групах тварин здійснювали об'ємне навантаження шляхом уведення в шлунок через зонд водогінної води в кількості 5 % від маси тіла. Після цього тварин поміщали на 2 год. у індивідуальні обмінні клітки для збирання сечі. У сечі та плазмі крові визначали концентрацію іонів натрію методом полум'яної фотометрії на ФПЛ-1, креатинін у сечі визначали за методом Фоліна, в плазмі крові – за методом Попера у модифікації Мерзона за реакцією з пікриною кислотою із наступним колориметруванням на спектрофотометрі СФ-46. Клубочкову фільтрацію