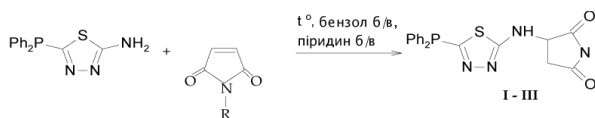


### Схема



де R = -o-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (I), -p-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub> (II), -o-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>-Br (III)

Критерієм оцінки токсичності сполук I-III вважався відсоток загибелі лабораторних тварин (білі нелінійні миші-самці вагою 22,0±2,0 г). Експерименти показали, що сполуки I-III відносяться до малотоксичних сполук, значення ЛД<sub>50</sub> для них становить 560 мг/кг, 628 мг/кг, 650 мг/кг, відповідно.

При дослідженні протисудомної активності сполук I-III критерієм оцінки вважався відсоток гальмування судомних ефектів у лабораторних тварин після введення коразолу. Виявлено, що сполуки I-III не проявляють протисудомної дії, але потенціюють судомну дію коразолу, викликаючи кровотечі у піддослідних тварин. Однак, синтезовані сполуки I-III можуть бути перспективними як потенційно біологічно активні для подальшого вивчення їх біологічних властивостей.

### СИНТЕЗ ТА ДОСЛІДЖЕННЯ ТОКСИЧНОСТІ НОВИХ ПОХІДНИХ 2-МЕРКАПТОАНІЛІНУ

Вельчинська О.В., Ніженковська І.В., Вільчинська В.В., Ніженковський О.І., \*Чумак Н.Є.  
Національний медичний університет  
ім. О.О. Богомольця, Київ;  
\*Інститут екогігієни і токсикології  
ім. Л.І. Медведя МОЗ України, Київ

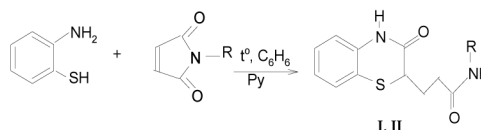
Робота присвячена синтезу нових біологічно активних сукцинімідів на основі N-заміщених малеїнімідів та 2-меркаптоаніліну, який використовувався у якості сіркувмісного синтону; дослідженню їх токсичності і біологічної активності.

**Мета даної роботи** полягає в хімічній модифікації молекул N-заміщених малеїнімідів з подальшим вивченням біологічної активності їх нових синтезованих похідних, а саме: після конструювання потенційно активних структур розроблено нові препаративні методи синтезу оригінальних гетероциклів на основі N-заміщених малеїнімідів та 2-меркаптоаніліну, досліджена токсичність синтезованих сполук. Реакція N-заміщеного малеїніміду з 2-меркаптоаніліном є типовим прикладом нуклеофільного приєднання по подвійному зв'язку.

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°C та перемішуванні ре-

акційної суміші 1-5 годин з обробкою продуктів реакції розчином етилового спирту у воді (1:1) та безводним бензолом (схема).

### Схема



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

Для визначення середньотоксичної дози ЛД<sub>50</sub> синтезованих сполук I, II використовували експрес-метод В.Б. Прозоровського. Критерієм оцінки токсичності сполук I, II вважався відсоток загибелі лабораторних тварин (білі нелінійні миші-самці вагою 22,0±2,0г). Експерименти показали, що сполуки I, II відносяться до малотоксичних сполук, значення ЛД<sub>50</sub> для них 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. Встановлено, що сполуки I, II не проявляють протисудомної активності та вираженого потенціюючого ефекту на судомну дію коразолу. Однак, під час проведення біологічного скринінгу для сполук I, II виявлено бактерійну та фунгіцидну види активності.

### ПРОТИПУХЛИННА АКТИВНІСТЬ БІС- АДДУКТУ 5-МЕТИЛУРАЦИЛУ

Вельчинська О.В., Вільчинська В.В.  
Національний медичний університет  
ім. О.О. Богомольця

Робота присвячена синтезу біс-аддукту 5-метилурацилу, який синтезовано на основі 5-метилурацилу і відомого інгаляційного анестетика фторотану у молярному співвідношенні 2:1, та дослідженню його протипухлинної активності.

Насьогоднішній день цілком закономірними є пошуки шляхів елімінації пухлинних клітин із множинною лікарською стійкістю за допомогою різних механізмів. Сучасні імунотерапевтичні агенти впливають як на пухлину, так і на різні регуляторні системи організму (в тому числі й на імунну систему) і призводять до протипухлинного ефекту. Важливою є розробка сучасних лікарських засобів, що сприяють захисту організму людини від шкідливого впливу факторів навколишнього середовища. Одним з перспективних шляхів пошуку засобів лікування пухлинної хвороби є створення нових антиметаболітів піримідинового обміну, здатних впливати на структуру та функції нуклеїнових кислот. Наявність цих речовин в організмі людини і обумовила актуальність дослідження їхньої ролі у