

Куликовская К. Ю., Журавель И. А.
**ОПРЕДЕЛЕНИЕ ЦИТОТОКСИЧНОСТИ ПРОИЗВОДНЫХ
3-ТИОКСО-[1,2,4]ТРИАЗОЛО[4,3-*a*]ПИРАЗИН-8-ОНОВ**
Научный руководитель д-р хим. наук, проф. Журавель И. А.
Кафедра токсикологической химии
Национальный фармацевтический университет, г. Харьков

Актуальность. Метод исследования цитотоксичности вновь синтезированных веществ на культурах клеток широко используется в странах Европы и США как экспресс-метод в токсикологии, фармакологии, косметологии. Он позволяет уйти от широкого спектра экспериментов на животных и, тем самым, приобретает все большее развитие как альтернативный метод биологических исследований.

Цель. Целенаправленный синтез биологически активных соединений ряда [1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиразинов и изучение их цитотоксических свойств.

Задачи:

1 Разработать подходы и произвести синтез N^7 -арил/бензил-3-тиоксо-2,3-дигидро-7*H*-[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиразин-8-онов.

2 Исследовать цитотоксические свойства синтезированных соединений.

Материал и методы. В данной работе нами рассмотрен метод оценки токсичности веществ с помощью тест-системы CellTiter-Glo (Promega). Метод позволяет оценить влияние исследуемых веществ на жизнеспособность клеток, в частности клеток рака предстательной железы линии Du₁₄₅.

Результаты и их обсуждение. В качестве объектов исследования нами выбраны ранее синтезированные N^7 -арил/бензил-3-тиоксо-2,3-дигидро-7*H*-[1,2,4]триазоло[4,3-*a*]пиразин-8-оны, которые получали на основе моноэфиров оксаламовых кислот. С использованием разработанной синтетической методики было получено 14 соединений данного ряда. Исследуемые вещества растворяли в ДМСО; в качестве контрольных ингибиторов использовали туберцидин и таксол в концентрациях 20 мМ и 200 мкМ соответственно. Влияние веществ на жизнеспособность клеток оценивали фотометрически по изменению интенсивности люминесценции.

Выводы. Нами установлено, что синтезированные соединения не проявляют цитотоксического действия, поэтому могут быть использованы, как перспективные субстанции для поиска безопасных фармакологически активных субстанций.