

Пругло Е. С., Гоцуля А. С.
ДИУРЕТИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ
3-(5-БРОМФУРАН-2-ИЛ)-4-R-(4H)-1,2,4-ТРИАЗОЛ-5-ТИОНОВ,
ИХ S-ПРОИЗВОДНЫХ И 2-(5-БРОМФУРАН-2-ИЛ)-5-R'-ТИАЗОЛ[3,2-b]
[1,2,4-]ТРИАЗОЛ-6(5H)-ОНОВ

Научный руководитель: д-р. фарм. наук, проф. Панасенко А. И.
Кафедра токсикологической и неорганической химии
Запорожский государственный медицинский университет, г. Запорожье

Актуальность. Сегодня известен широкий ассортимент диуретиков, но ни один из них не является абсолютно безопасным.

Цель: поиск малотоксичных и высокоактивных диуретиков среди 5-бромфуран-2-ил производных 1,2,4-триазола.

Задачи:

Изучение диуретической активности 15 соединений: 3-(5-бромфуран-2-ил)-4-R-(4H)-1,2,4-триазол-5-тионов, их S-производных и 2-(5-бромфуран-2-ил)-5-R'-тиазол[3,2-b][1,2,4-]триазол-6(5H)-онов.

Материалы и методы. Метод Е. Б. Берхина на белых нелинейных крысах по 7 крыс в каждой серии (всего 147). Мочу собирали через каждый час в течение 2-х и 4-х часов. Соединения вводили в дозе 1/10 от ЛД₅₀. Исследование и анализ полученных экспериментальных данных проводили по сравнению с эталонными диуретиками: гипотиазидом и фуросемидом.

Результаты и их обсуждение. Исследуемые соединения в большинстве своем относятся к диуретикам короткого действия. Активными оказались четыре соединения, которые по своему действию превосходят препарат сравнения фуросемид за 2 часа, и повышают диурез на 159,34 - 203,23 % соответственно, тогда как фуросемид за 2 часа увеличивал выделительную функцию почек только на 158,06 %.

Среди исследуемых веществ производных 1,2,4-триазола также было обнаружено антидиуретическое действие двух соединений, которые уменьшали диуретическое действие за 2 часа на 52,75 и 50% соответственно.

Выразительное антидиуретическое действие одного соединения проявляется не только через 2 часа, но и через 4. Так диуретическое действие под влиянием первого соединения через 4 часа уменьшалось на 36,18%.

Проанализировав данные исследований за 4 часа было обнаружено, что наиболее активным веществом среди производных 1,2,4-триазола оказался морфолиний 2-((5-бромфуран-2-ил)-4-этил-1,2,4-триазол-3-илтио)ацетат, который повышал диуретическое действие на 151,97% по отношению к гипотиазиду и приближался к фуросемиду.

Выводы:

- 1 Исследовано 15 соединений на диуретическую активность.
- 2 Морфолиний 2-((5-бромфуран-2-ил)-4-этил-1,2,4-триазол-3-илтио)ацетат требует углубленных исследований в плане создания на его основе биологически активной субстанции с диуретическим действием.