



Міністерство охорони здоров'я України
Міністерство освіти і науки України
Національний фармацевтичний університет
Кафедра фармацевтичної хімії
Кафедра загальної хімії

Міжнародна internet-конференція

Modern chemistry of medicines

25 вересня 2024 р.
м. Харків, Україна

Посвідчення Державної наукової
установи «Український інститут
науково-технічної експертизи та
інформації» № 263 від 16.04.2024 р.

Міністерство охорони здоров'я України
Міністерство освіти і науки України
Національний фармацевтичний університет
Кафедра фармацевтичної хімії
Кафедра загальної хімії

Ministry of health of Ukraine
Ministry of education and science of Ukraine
National university of pharmacy
Pharmaceutical chemistry department
General chemistry department

MODERN CHEMISTRY OF MEDICINES

Матеріали

**Міжнародної Internet-конференції «Modern chemistry of medicines»,
до 85-річчя з дня народження професора Петра Овксентійовича Безуглого
25 вересня 2024 року**

Materials

**of the International Internet Conference 'Modern chemistry of medicines',
dedicated to the 85th Anniversary of Professor Petro O. Bezuglyi
September 25, 2024**

**ХАРКІВ
KHARKIV
2024**



УДК 615.3(06)
М 78

Електронне видання мережне

Редакційна колегія: проф. Котвіцька А.А., проф. Федосов А.І., проф. Владимірова І.М., проф. Георгіянц В.А., проф. Перехода Л.О., проф. Колісник С.В., доц. Криськів О.С., проф. Власов С.В., проф. Северіна Г.І., проф. Подольський І.М., доц. Михайленко О.О., доц. Сулейман М.М., ас. Смелова Н.М., ас. Григорів Г.В., ас. Маслов О.Ю.

Конференція зареєстрована в УкрІНТЕІ (посвідчення № 263 від 16.04.2024 р.)

Modern chemistry of medicines: матеріали Міжнародної Internet-конференції (25 вересня 2024 р., м. Харків) – Електрон. дані. – Х. : НФаУ, 2024. – 160 с. – Назва з тит. екрана.

Збірник містить матеріали Міжнародної Internet-конференції «Modern chemistry of medicines» (25 вересня 2024 р., м. Харків) присвячені висвітленню сучасних тенденцій створення оригінальних АФІ синтетичного та рослинного походження, фармацевтичної розробки, забезпечення якості лікарських засобів.

Для широкого кола наукових та практичних фахівців у галузі фармації та медицини, магістрантів, аспірантів, докторантів, співробітників фармацевтичних підприємств, викладачів закладів вищої освіти.

*Редколегія не завжди поділяє погляди авторів.
Автори опублікованих матеріалів несуть повну відповідальність за підбір,
точність наведених фактів, цитат, економіко-статистичних даних,
власних імен та інших відомостей.
Матеріали подаються мовою оригіналу.*

УДК 615.3(06)

© НФаУ, 2024



Визначення механізму інгібування бутирилхолінестерази дезлоратадином

Роман Смішко^{1*}, Анастасія Бегдай¹, Ольга Сив'юк¹, Вадим Лісовий¹, Галина Кузьміна¹,
Володимир Бессарабов^{1,2}

¹ Київський національний університет технологій та дизайну, Київ, Україна

² Інститут фізико-органічної хімії та вуглехімії ім. Л.М. Литвиненка НАН України, Київ

*e-mail: smishko.ro@kntud.edu.ua

Вступ. Бутирилхолінестераза (БХЕ) є важливим ферментом, який присутній майже у всіх тканинах та органах людини та відіграє важливу роль у розщепленні низки нейромедіаторів і ксенобіотиків. порушення нормального функціонування БХЕ може призвести до розвитку різноманітних патологічних станів, зокрема нейродегенеративних захворювань. Для покращення роботи нервової системи при нейродегенеративних розладах часто застосовують лікарські засоби, які є інгібіторами холінестераз, що, відповідно, призводить до підвищення рівня ацетилхоліну в мозку та підтримання його на належному рівні.

Впродовж останнього десятиліття у науково-літературних джерелах повідомляється про перспективу досліджень плеiotропних властивостей антигістамінних активних фармацевтичних інгредієнтів (АФІ), зокрема з метою їхнього потенційного перепрофілювання для фармакотерапії нейродегенеративних розладів [1]. Зважаючи на актуальність таких досліджень, для вивчення впливу на бутирилхолінестеразу обрано антигістамінний АФІ дезлоратадин.

Матеріали та методи. Дослідження виконано з використанням спектрофотометричного методу за модифікованою методикою Еллмана, яка ґрунтується на властивості тіохоліну, продукту реакції, яку каталізує бутирилхолінестераза, відновлювати жовто-забарвлений калій гексаціаноферат (III) до практично безбарвного калій гексаціаноферату (II). Це дозволяє здійснювати прямий фотометричний моніторинг швидкості ферментативної реакції. Швидкість зменшення оптичної густини розчину при довжині хвилі 405 нм прямо пропорційна активності БХЕ в досліджуваному зразку. Для визначення типу інгібування дезлоратадином бутирилхолінестерази проведено серію розрахунків в різних умовах з ранжируванням результатів за критерієм значення коефіцієнта кореляції (R^2). Оцінку кінетики досліджуваного процесу здійснювали в програмі для аналізу та візуалізації даних SigmaPlot 14.0.

Результати та обговорення. Встановлено, що дезлоратадин інгібує бутирилхолінестеразу з $IC_{50}=131,4\pm 13,0$ мкМ. При встановленні механізму інгібування ферменту даним антигістамінним АФІ з'ясовано, що дезлоратадин пригнічує бутирилхолінестеразу за змішаним (частковим) механізмом ($R^2 = 0,981$). Ймовірно, що він зв'язується як у активному центрі ферменту, так і зовні, а фермент-субстратний комплекс зберігає часткову активність у порівнянні з нативним ферментом.

Висновки. Встановлено, що дезлоратадин може інгібувати бутирилхолінестеразу, що, відповідно, розширює його фармакологічний профіль та відкриває нові перспективи для клінічних досліджень щодо можливостей потенційного використання антигістамінних засобів на основі дезлоратадину з метою лікування та профілактики нейродегенеративних захворювань.

Список літератури

1. Tandra G, Yoone A, Mathew R, Wang M, Hales CM, Mitchell CS. Literature-Based Discovery Predicts Antihistamines Are a Promising Repurposed Adjuvant Therapy for Parkinson's Disease. *Int J Mol Sci.* 2023;24(15):12339.



Визначення домішок урсодеоксихолевої кислоти у твердих желатинових капсулах	118
Олена Салій, Ганна Тарасенко, Яна Ясько	
Фітофотодерматити, викликані рутою запашною	120
Сергієнко Тетяна, Георгіянц Вікторія, Скибітська Марія, Михайленко Ольга	
Підбір умов для кількісного визначення водорозчинних полісахаридів у лікарській рослинній сировині оману високого кореневищ та коренів	121
Наталія Смілова, Ольга Євтіфєєва, Ольга Головченко, Ольга Рудакова, Вікторія Георгіянц	
Визначення механізму інгібування бутирилхолінестерази дезлоратадином	122
Роман Смішко, Анастасія Бегдай, Ольга Сив'юк, Вадим Лісовий, Галина Кузьміна, Володимир Бессарабов	
Проблеми застосування компонентів рослинного походження при розробці косметичних засобів для вагітних	123
Галина Смойловська, Олена Малюгіна, Олена Єренко	
Валідація методики кількісного визначення вмісту води в 1,2,4-трихлорбензолі	124
Тетяна Соломінчук, Віталій Рудюк, Вікторія Георгіянц	
Перспективні біополімерні матеріали гемостатичної та кровоспинної дії	125
Ганна Тарасенко, Олена Салій, Віталіна Буцин, Олена Панкратова	
Кінетичне дослідження інгібування рутином окиснення дофаміну	125
Владислав Удовиський, Валентина Древуш, Марія Розумненко, Вікторія Лижнюк, Вадим Лісовий, Галина Кузьміна, Володимир Бессарабов	
Спектрофотометричне визначення концентрацій ароматичних та гетероциклічних амінокислот у подвійних і потрійних розчинах	127
Ірина Фарбун	
Синтез та властивості (4-(9-(4-метоксифеніл)-3-(метилтіо)піразоло [1,5-d][1,2,4]триазоло[3,4-f][1,2,4]триазин-6-іл)піперазин-1-іл) (алкіл-, арил-, гетерил)метанонів	128
Сергій Федотов, Андрій Гоцуля	
Синтез та властивості продуктів імідування серотоніну та гістаміну 4-заміщеними нафталевими ангідридами	129
Надія Федько, Віра Ведута, Катерина Мілінчук, Валерій Ластеженко	
Принципи «зеленої» хімії у виробництві сучасних фітопрепаратів	130
Ольга Хворост, Тетяна Опрошанська, Катерина Скребцова	