

МІНІСТЕРСТВО ОХОРОНИ ЗДОРОВ'Я УКРАЇНИ
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ
НАЦІОНАЛЬНИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ УНІВЕРСИТЕТ

СУЧАСНІ АСПЕКТИ СТВОРЕННЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ

Тези доповідей Міжнародної науково-практичної
дистанційної конференції, присвяченої
100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ

16 квітня 2021 року
м. Харків

Харків
НФаУ
2021

УДК 615.014(043.2)

С 89

Редакційна колегія:

проф. А. А. Котвіцька, проф. А. І. Федосов, проф. І. М. Владимірова,
проф. С. В. Колісник, проф. І. С. Гриценко

Сучасні аспекти створення лікарських засобів : тези допов.

С 89 Міжнар. наук.-практ. дистанц. конф., присвяченої 100-річчю кафедри аналітичної хімії НФаУ (16 квітня 2021 р.). – Х. : НФаУ, 2021. – 224 с.

Збірка містить матеріали Міжнародної науково-практичної дистанційної конференції «Сучасні аспекти створення лікарських засобів» (16 квітня 2021 р.) за науковими напрямками: конструювання, синтез і модифікація біологічно активних сполук, дослідження зв'язку структура – активність, методи фармакологічного скринінгу; сучасні підходи до створення нових лікарських та косметичних засобів, функціональних харчових та дієтичних добавок; аналітичні аспекти у синтезі біологічно активних сполук та створенні нових лікарських засобів; контроль якості лікарської рослинної сировини, фітопрепаратів, парфумерно-косметичних засобів та функціональних харчових добавок; сучасний фармацевтичний аналіз та стандартизація ліків; хіміко-токсикологічний аналіз біологічно активних речовин та лікарських засобів.

Для широкого кола науковців та практичних працівників фармації і медицини.

Матеріали подаються мовою оригіналу. За достовірність опублікованих результатів повну відповідальність несуть автори.

УДК 615.014(043.2)

CHARACTERIZATION OF NOVEL TELLURIUM-FUNCTIONALIZED THIAZOLOTHIENOPYRIMIDINIUM SYSTEMS WITH ANTIMALARIAL ACTIVITY *IN VITRO*

Kut M.¹, Kut D.¹, Cipriano S.S.², Maluf S.E.C.², Ferrara T.F.³, Azevedo M.F.⁴,
Carmona A.K.³, Onysko M.¹, Lendel V.¹, Cunha R.L.O.R.²

¹*Uzhhorod National University, Uzhhorod, Ukraine*

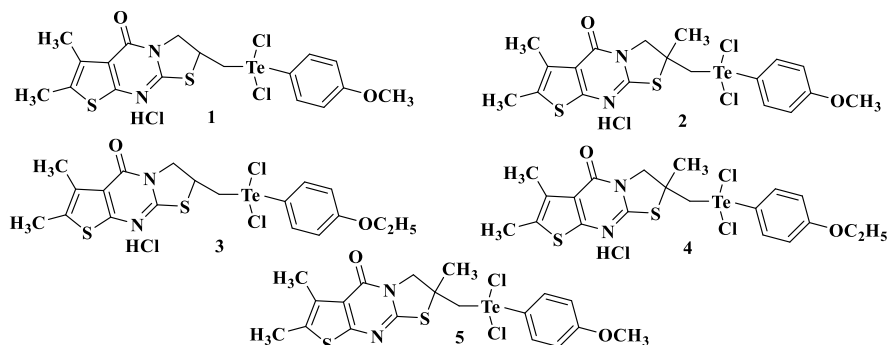
²*Universidade Federal do ABC, Santo André, Brazil*

³*Universidade Federal de São Paulo, São Paulo, Brazil*

⁴*Universidade Federal de São Paulo, Santos, Brazil*

kutmykola@ukr.net

Malaria causes millions of victims every year around the world. Among the considered druggable targets to develop new malaria chemotherapy agents, proteolytic enzymes are very attractive due to their critical roles in the life cycle of malaria parasites. During the erythrocytic stage of infection, *Plasmodium* proteases process host's hemoglobin and also facilitates parasite invasion and evasion from erythrocytes. Thus, protease inhibitors are promising therapeutical agents for malaria treatment. Organotelluranes are a class of selective and potent cysteine protease inhibitors as demonstrated previously for cathepsins and caspases. As part of a program to explore biological activities of organotelluranes, the action of a set of related organotelluranes **1-5** in malaria model was assessed.



Herein, we evaluated a group of heterocyclic organotelluranes against a 3D7 strain of *Plasmodium falciparum in vitro*, the inhibition of recombinant Falcipain-2 and intracellular proteolytic activity of isolated parasites and the effect on isolated erythrocytes and HUVEC cells as an approach to study compounds toxicity.

All compounds were able to decrease parasitemia at 72 hours significantly accompanied by significant intracellular proteolysis inhibition (IC₅₀ values up to 10 μM). These compounds did not lead to considerable cytotoxicity or hemolysis at concentrations close to the EC₅₀ or IC₅₀. The group of compounds was also able to inhibit Falcipain II with Ki values about 1 μM. Despite there is some apprehension about the use of tellurium compounds as chemotherapeutics, some compounds have shown negligible acute toxicities. Thus, our results demonstrate the importance of the organic moieties of organotelluranes to modulate their activities. Collectively, our results suggest that these compounds have a potential to be further improved and strengthen the potential of tellurium-based antimalarial drugs.