

ПОИСК БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ СОЕДИНЕНИЙ В РЯДУ ПРОИЗВОДНЫХ ОКСАМИДОЭТАНОВОЙ КИСЛОТЫ

Банная Н.И., Самура Б.А., Банный И.П.
Национальный фармацевтический университет, Харьков

Эффективность диагностики и лечения целого ряда заболеваний в значительной степени зависит от имеющегося арсенала лекарственных средств, поэтому создание новых и совершенствование имеющихся в наличии лекарственных препаратов играет важную роль для современного практического здравоохранения.

Известно, что дикарбоновые кислоты и их производные являются природными метаболитами, которые играют определяющую роль в транс-гидрогеназных реакциях перемещения протонов, электронов и катионов, участвующих в процессах энергообмена, биосинтеза протеинов и других биологических компонентов человеческого организма.

Производные щавелевой, оксаминовой и оксаниловой кислот на протяжении нескольких десятков лет являются объектом пристального внимания химиков-синтетиков и фармакологов, так как в этих рядах соединений найдены вещества с широким спектром фармакологической активности и низкой токсичностью.

Аминоэтановая кислота (аминоуксусная кислота, гликокол, глицин) играет важную роль в организме, участвуя в выведении бензойной кислоты, биосинтезе многих биологически активных веществ.

Целью наших исследований было осуществить синтез соединений, молекулы которых наряду с зарекомендовавшими себя фармакофорами замещенными сульфамидными группами, оксамидным радикалом, а также различными гидрофильными и гидрофобными радикалами, содержали бы фрагмент аминоэтановой кислоты и изучить влияние последней на проявление фармакологического эффекта и токсичности соединений.

В результате амидирования метиловых и этиловых эфиров замещенных оксаминовых кислот аминоэтановой кислотой в присутствии эквимолекулярного количества гидроксида калия при комнатной температуре с высокими выходами получены замещенные оксамидоэтановые кислоты.

Результаты фармакологического скрининга показали, что в изученных рядах соединений найдены вещества превосходящие по активности препараты сравнения.