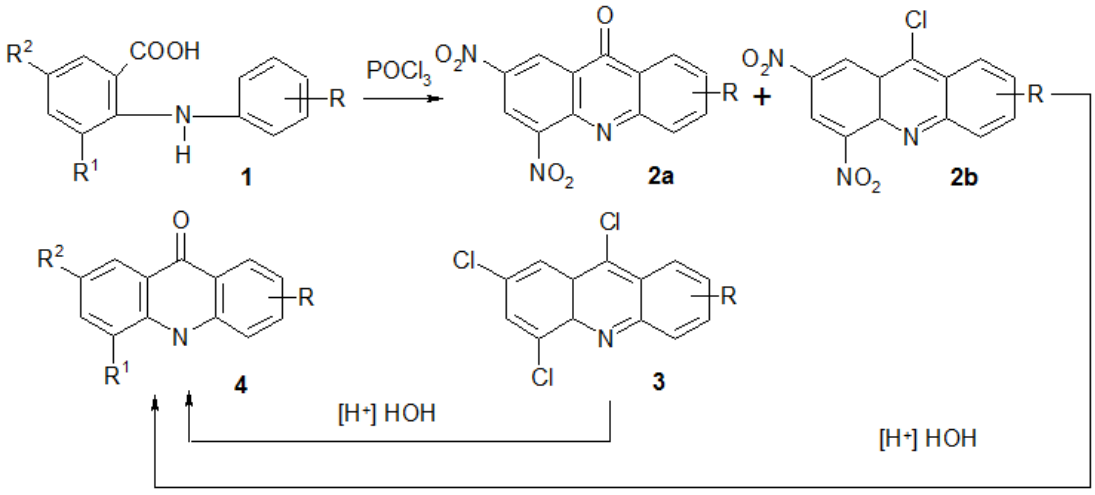
СИНТЕЗ, БУДОВА ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ 5,7-ДИХЛОР- ТА 5,7-ДИНІТРОАКРИДОНІВ-9

А.О. Девяткіна, І.І. Іванова, С.Г. Ісаєв, І.А. Сокуренко, Г.П. Жегунова
Національний фармацевтичний університет,
Україна, 61002, Харків, вул. Пушкінська, 53
E-mail: medchem@ukrfa.kharkov.ua

Ціленаправленний пошук сполук, які проявляють біологічну дію, вимагає систематизації досліджень про зв'язок структури з біологічною активністю. У цьому плані, особливе місце займають похідні N-фенілантранілової кислоти та акридину, які проявляють різноманітні види фармакологічної дії.

У продовження раніше приведенних досліджень здійснено синтез нових 5,7-дихлор- та 5,7-динітроакридонів-9 (схема), N-фенілантранілові кислоти (1) отримані по модифікованій реакції Ульмана шляхом конденсації 2-хлор-3,5-динітро- або 2,3,5-трихлорбензойної кислот з ариламінами у присутності оксиду міді та карбонату калія без розчинника при температурі нагрівання 180-220°С протягом 2-х годин. Циклізацією N-фенілантранілових кислот (1) двократним по масі надлишком хлорокису фосфору отримані тільки 5,7,9-трихлоракридини (3). Синтезувати 5,7-динітро-9-хлоракридини не було можливим у наслідок швидкого окислення 9-хлоракридинів до акридонів-9. Тому суміш продуктів 5,7-динітро-9-хлоракридина (2а) і відповідного акридона-9 (2б) обробляли 0,5М розчином хлористоводневої кислоти з метою одержання 5,7-динітроакридонів-9 у чистому вигляді.



R^1=R^2=Cl, NO_2
R=H, CH_3, OCH_3, Cl, Br

Будова сполук (4) підтверджена даними елементного аналізу, ІЧ-спектрів, а їх індивідуальність – методом хроматографії у тонкому шарі сорбента. За результатами біологічного скринінгу виявлені сполуки з протимікробною, протигрибковою, протизапальною активністю (DL_{so} > 3000 мг\кг при внутрішньошлунковому введенні).