

ПОШУК НОВИХ ЛІКАРСЬКИХ СУБСТАНЦІЙ НА ОСНОВІ 3,5-ДИНІТРО-N-ФЕНІЛАНТРАНІЛОВИХ КИСЛОТ

Ісаєв С.Г., Іванова І.І., Кізь О.В., Гріневич Л.О.

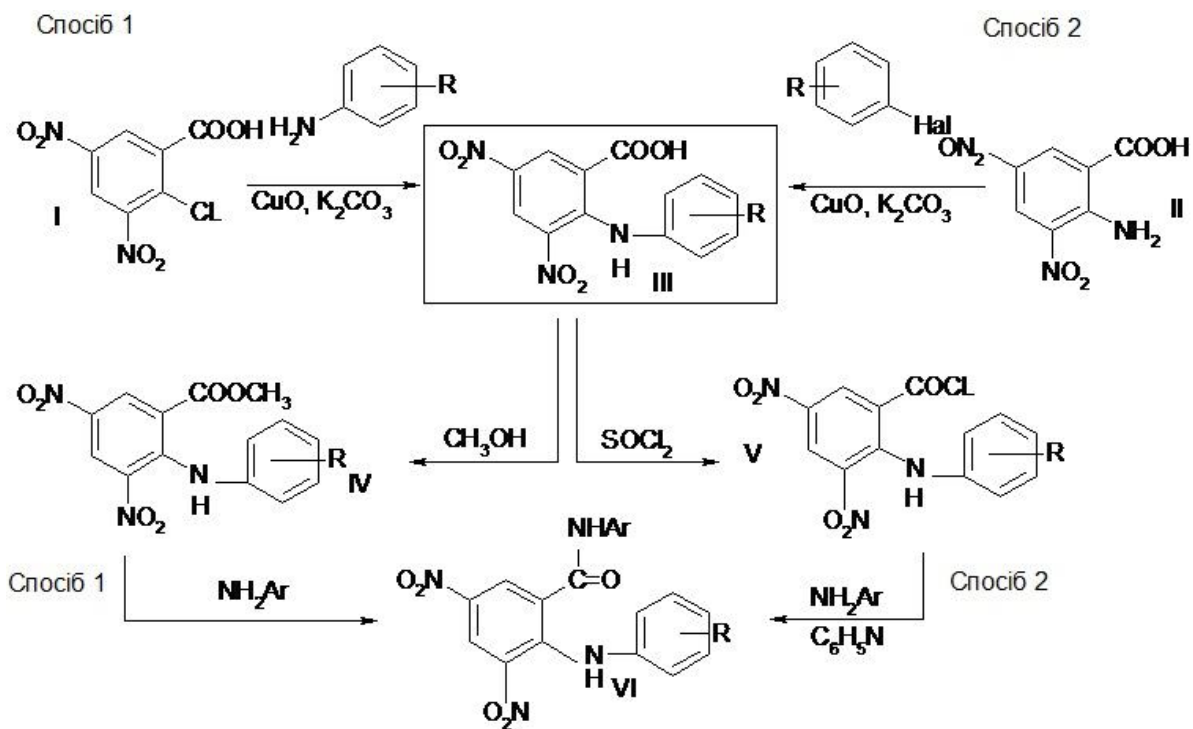
Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

medchem@ukrfa.Kharkov.ua

Перспективним науковим напрямком в плані пошуку фармакологічно активних речовин є дослідження в ряду N-фенілантранілових кислот (N-ФАК) та їх похідних. Серед вищеназваних структур створені лікарські засоби та знайдені високоактивні в фармакологічному плані субстанції (С.Г. Ісаєв 1986-2014). Отримані дані визначили необхідність подальшого розширення хімічного і фармакологічного вивчення раніше не досліджених 3,5-динітро-N-ФАК та їх похідних. Заміщені 3,5-динітро-N-ФАК (III) синтезовані двома способами, використовуючи їх три модифікації: взаємодією 3,5-динітро-2-хлорбензойної кислоти (I) з ариламином (сп. 1) та арилюванням 3,5-динітро-N-ФАК (II) заміщеними галогенбензолів (сп. 2) у присутності CuO , K_2CO_3 в середовищі n-амілового спирту, ДМФА у твердій фазі.

На основі 3,5-динітро-N-ФАК (III) здійснено синтез їх метилових естерів (IV) та анілідів (VI). Будову синтезованих речовин (III, IV, VI) підтверджено сучасними фізико-хімічними методами та зустрічним синтезом.

Вивчення фармакологічної активності синтезованих сполук проводилось на кафедрах медико-біологічного профілю НФаУ та в Харківській зооветеринарній академії. Синтезовані сполуки проявляють протизапальну, діуретичну, антидіуретичну, фунгістатичну та бактеріостатичну активність при низькій токсичності.



Встановлено, що етерифікація карбоксильної групи в 3,5-динітро-N-ФАК призводить до збільшення протизапального та діуретичного ефектів, а також зниження гострої токсичності.

Аніліди 3,5-динітро-N-ФАК за бактеріостатичним ефектом перевищують відповідні N-фенілантранілові кислоти та їх метилові естери.