

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ γ-КАРБОКСИПРО-ПИЛАМИДОВ ЗАМЕЩЕННЫХ ОКСАНИЛОВЫХ КИСЛОТ

Самура Б.А., Боб Н.И., Банный И.П., Савченко В.Н.
Национальный фармацевтический университет, Харьков

Одной из важнейших задач современной фармацевтической науки является поиск подходов к решению проблемы целенаправленного синтеза ранее неизвестных групп биологически активных соединений и создание на их основе высокоэффективных биологически активных и безопасных лекарственных препаратов.

Необходимость более глубокого анализа зависимости фармакологической активности от химической структуры, с целью повышения эффективности биологически активных веществ, обуславливает разработку новых методов целенаправленного синтеза биологически активных соединений.

Целью наших исследований было осуществить синтез и изучить острую токсичность, диуретическую, противовоспалительную и анальгетическую активность новой группы соединений γ-карбокситриламинов замещенных оксаниловых кислот.

В опытах на мышах установлено, что для новых соединений LD_{50} при внутрижелудочном введении составляет 1515-2410 мг/кг. Соответственно острая токсичность препаратов сравнения: гипотиазида 1175 мг/кг, фуросемида 1000 мг/кг, анальгина 1197 мг/кг, диклофенака 360 мг/кг.

Анализ результатов изучения диуретической активности показал, что все изученные соединения вызывают увеличение функции почек в среднем на 31,2-80,2%. Выраженную диуретическую активность, которая превышает действие гипотиазида, проявляет соединение, содержащее метил радикал, которое за 2 часа увеличивало диурез на 68,4%, а за 4 часа – на 80,2%.

Противовоспалительную активность изучали на модели карагенинового отека на беспородных белых крысах. Изученные соединения проявляют умеренную противовоспалительную активность.

Результаты изучения анальгетической активности показали, что большинство соединений проявляют умеренную активность. Наиболее активным оказалось соединение, содержащее этоксикарбонильный радикал.

По результатам исследований можно предположить о результативности дальнейших исследований в данном ряду соединений.