

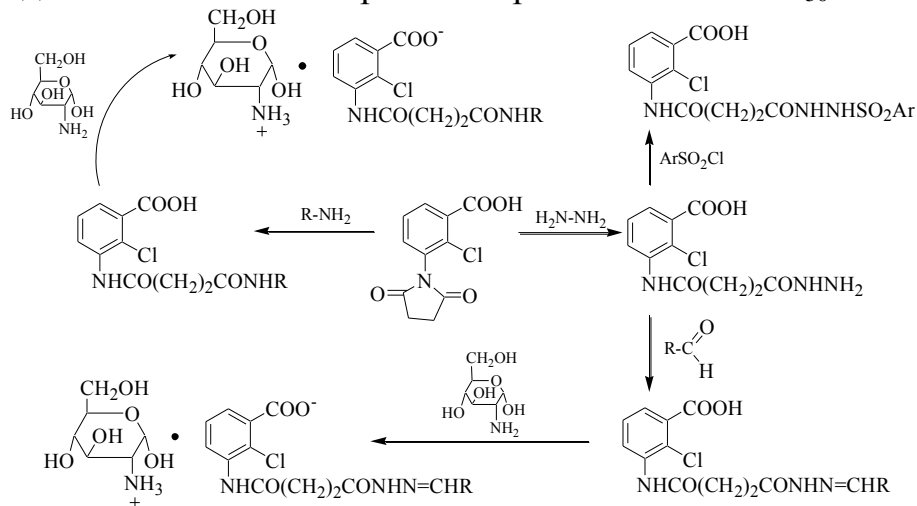
УДК: 547.459.5:547.461.4

**СТРАТЕГІЯ ПОШУКУ БІЛОГІЧНО АКТИВНИХ РЕЧОВИН
СЕРЕД ПОХІДНИХ Д-(+)-ГЛЮКОЗАММОНІЄВИХ СОЛЕЙ
3-КАРБОКСИ-2-ХЛОРСУКЦИНАНІЛОВОЇ КИСЛОТИ**

Сулейман М.М., Друговіна В.В., Сергієнко О.М., Яременко В.Д., Перехода Л.О.
Національний фармацевтичний університет, м. Харків, Україна

Серед похідних бурштинової кислоти знайдено багато біологічно активних сполук різноманітної фармакологічної дії, деякі з них мають застосування у сучасній медичній практиці.

Метою дослідження було отримання нових сполук серед похідних N-іміду-3-карбоксі-2-хлорсукцинанілової кислоти та її похідних - R-іденгідрозидів, аренсульфогідразидів та їхніх Д-(+)-глюкозаммонієвих солей, синтез яких наведено за наступною схемою, здійснення оцінки їх біологічного потенціалу за допомогою математичного моделювання, проведення первинного фармакологічного скринінгу з метою встановлення взаємозв'язку структура-активність, а також для найбільш активних представників виявлення рівня гострої токсичності DL₅₀.



Структура отриманих сполук підтверджена за допомогою сучасних методів аналізу – ІЧ-, УФ-, ЯМР-спектроскопії, а ступінь чистоти - методом ТШХ. Прогноз видів біологічної активності проводився за допомогою математичної програми PASS. Протизапальну активність проводили на моделі каррагенінового набряку у щурів лінії Вістар. Протимікробну активність визначали на моделі двократних серійних розведень в поживному середовищі – м'ясопептонному бульйоні та на моделі паперових дисків, просякнених розчинами різної концентрації у порівнянні до деяких антибіотиків. Гостра токсичність виявлялась при внутрішньочеревинному введенні лабораторним мишам.

Синтезовані речовини проявляють виражену протизапальну та бактеріостатичну активність не перевищуючи тест препарати. Введення глюкозаміну як катіонного фрагменту в сіль обумовлює збільшення протизапальної дії та зменшення токсичності до 1000-1500 мг/кг.

Подальші дослідження доцільно проводити у напрямку введення до структури молекули N-іміду-3-карбоксі-2-хлорсукцинанілової кислоти залишків амінокислот.