

**ЗАКОНОМІРНОСТІ ЗВ'ЯЗКУ "БУДОВА – ДІУРЕТИЧНА ДІЯ"  
В РЯДУ *N*-БЕНЗИЛ-6-ГІДРОКСИ-2-МЕТИЛ-4-ОКСО-2,4-ДИГІДРО-1*H*-  
ПІРОЛО[3,2,1-*ij*]ХІНОЛІН-5-КАРБОКСАМІДІВ**

Голік М.Ю.<sup>1</sup>, Українець І.В.<sup>1</sup>, Сидоренко Л.В.<sup>1</sup>, Сім Г.<sup>2</sup>

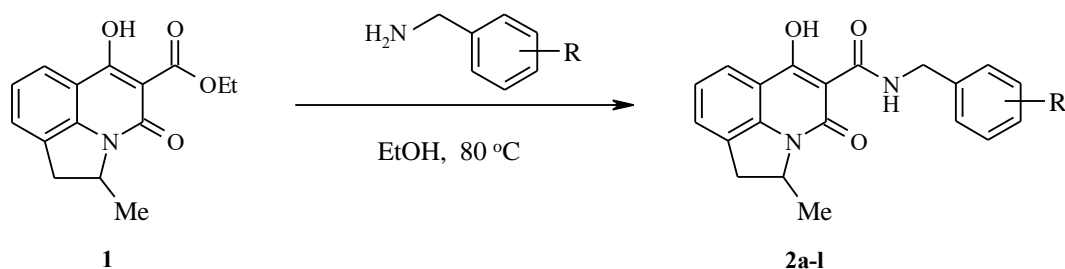
<sup>1</sup>*Національний фармацевтичний університет, Харків, Україна*

<sup>2</sup>*Далекозахідний державний медичний університет, Хабаровськ, Росія*

*aptekar4009@gmail.com*

Проведений нами раніше порівняльний аналіз впливу на сечовидільну функцію нирок декількох серій 6-гідрокси-4-оксо-2,4-дигідро-1*H*-піроло[3,2,1-*ij*]-хінолін-5-карбоксамідів показав, що метилування піролінового циклу у положення 2 на діуретичному ефекті позначається неоднозначно: в одних випадках спостерігається посилення сечогінних властивостей, в інших їх помітний спад. До яких результатів призведе означена хімічна модифікація у разі бензиламідів дати відповідь зможе тільки експеримент, якому і присвячене дане повідомлення.

Синтез об'єктів дослідження здійснено амідуванням етил-6-гідрокси-2-метил-4-оксо-2,4-дигідро-1*H*-піроло[3,2,1-*ij*]хінолін-5-карбоксилату (1) відповідними бензиламинами у киплячому етанолі:



2: R = H (a); R = 2-F (b); R = 4-F (c); R = 2-Cl (d); R = 4-Cl (e); R = 2-Me (f); R = 3-Me (g);  
R = 4-Me (h); R = 2-OMe (i); R = 4-OMe (j); R = 3,4-(OMe)<sub>2</sub> (k); R = 3-CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-4 (l).

Будова усіх одержаних нами *N*-бензил-6-гідрокси-2-метил-4-оксо-2,4-дигідро-1*H*-піроло[3,2,1-*ij*]хінолін-5-карбоксамідів (2a-l) підтверджена даними елементного аналізу, спектрами ЯМР (<sup>1</sup>H та <sup>13</sup>C), а також мас-спектрами.

Порівняльний аналіз результатів фармакологічного тестування з даними попередніх досліджень свідчить про те, що у більшості розглянутих випадків 2-метильна група практично повністю позбавляє молекулу сечогінних властивостей. Виключення складає лише перший член дослідженого ряду – *N*-бензил-6-гідрокси-2-метил-4-оксо-2,4-дигідро-1*H*-піроло[3,2,1-*ij*]хінолін-5-карбоксамід (2a). Тут метилування піролінового циклу на діурезі позначилося позитивно – бензиламід 2a за специфічною активністю перевищив не тільки свого неметильованого аналога, а й препарат порівняння – гідрохлоротіазид, причому у значно нижчій дозі.