# МЕТОДИ СИНТЕЗУ β-N-R-ЗАМІЩЕНИХ ГІДРАЗИДІВ 5-БРОМ-2-ХЛОРБЕНЗОЙНОЇ КИСЛОТИ ТА ЇХ БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ

*Н.П. Кобзар, С.Г. Ісаєв, В.Д. Яременко, О.І. Павлій, О.М. Сергієнко, В.В. Друговіна, І.В. Фурда*

***Національний фармацевтичний університет,***

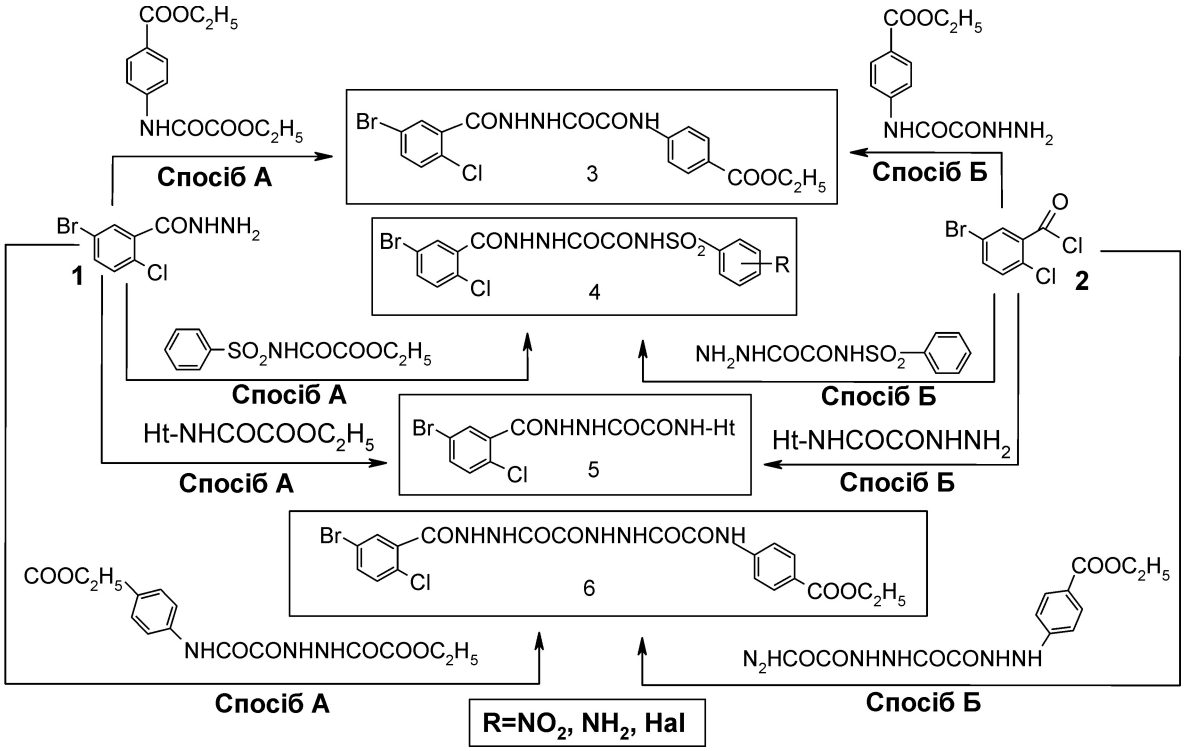
Україна, 61002, Харків-2, вул. Пушкінська, 53

*E-mail: medchem@ukrfa.kharkov.ua*

Дослідження вчених НФаУ (проф. П.О. Петюніна, В.П. Черних та ін.) свідчать, що введення в базові структури фрагменту щавлевої кислоти приводить до зниженню гострої токсичності та розширенню спектру фармакологічної дії.

З метою подальшого визначення залежності "структура-активність" синтезовані β-N-R-заміщені гідразиди 5-бром-2-хлорбензойної кислоти, які поєднують у своїй структурі два фармакофори – залишок о-хлорбензойної та оксанілової кислот.

Синтез β-N-R-заміщених гідразидів 5-бром-2-хлорбензойної кислоти (3-6) здійснювався двома способами: шляхом взаємодії гідразиду 5-бром-2-хлорбензойної кислоти (1) з етиловими ефірами оксанілових кислот при нагріванні в середовищі ДМФА (спосіб А) та взаємодією хлорангідриду о-хлорбензойної кислоти (2) з гідразидами оксанілових кислот (спосіб Б):




Будову синтезованих сполук підтверджено якісними реакціями, даними елементного аналізу, ІЧ-, ЯМР-спектроскопії, а чистоту – хроматографією в тонкому шарі сорбенту.

Синтезовані сполуки 3-6 виявляють виражену протизапальну, аналгетичну та діуретичну активності при низькій токсичності ($DL_{50}$: 2000-5000 мг/кг).