

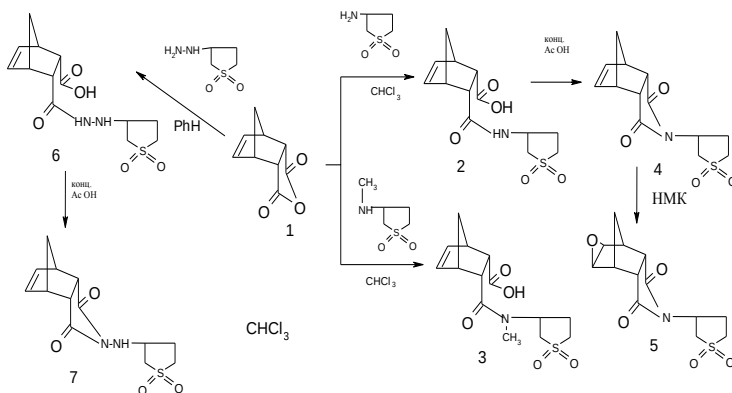
СИНТЕЗ ТА БІОЛОГІЧНА АКТИВНІСТЬ ПОХІДНИХ АНГІДРИДУ БІЦИКЛО[2.2.1]ГЕПТ-5-ЕН-ЕНДО, ЕНДО-2,3-ДИКАРБОНОВОЇ КИСЛОТИ З СУЛЬФОЛАНОВИМ ФРАГМЕНТОМ

Крищик О. В., Волошина М. С.

ДВНЗ «Український державний хіміко-технологічний університет», Дніпро, Україна
oxanakp15@gmail.com

Відомо, що іміди та амідокислоти на основі ангідриду біцикло[2.2.1]гепт-5-ен-ендо,ендо-2,3-дикарбонОВОЇ кислоти володіють антидепресантною, психотропною, нейротропною активністю, використовуються як протиаритмічні, седативні, жарознижуючі, протизапальні засоби. Амідокислоти на основі ангідриду біцикло[2.2.1]гепт-5-ен-ендо,ендо-2,3-дикарбонОВОЇ кислоти використовуються також як репеленти, рістрегулятори та гербіциди.

Метою цього дослідження є розробка методів синтезу сульфанамідівмісуючих сполук, які включають також норборненовий фрагмент. У групу сполук, яка досліджувалася включені сполуки, які містять декілька фармакофорних фрагментів, зокрема амінокислоти 2, 3 – продукти взаємодії ендикового ангідриду 1 з 3-аміно та 3-метиламіноссульфан-1,1-діокси, імід 4 та його епоксидне похідне 5 та гідразиди 6,7. Імід 4 отримано кип'ятінням амідів 2 у крижаній оцтовій кислоті та далі перетворено в епоксид 5 окисненням надмугариною кислотою в умовах реакції Прилежаєва.



Структура синтезованих сполук підтверджена даними ІЧ, ЯМР¹H, C¹³ спектроскопії. В ІЧ спектрах амідокислот амідна група проявляється у вигляді смуг «амід І та амід ІІІ» в областях 1640-1622 та 1288 см⁻¹, які відносяться до валентних коливань карбонильної групи та зв'язку С–N відповідно.

Спектри ЯМР¹ амідокислот 2,3 містять сигнали олефінових протонів в області 5,90-6,29 м.д., передмістових протонів в області 2,84-2,97 м.д.

Дослідження фармакологічної активності сполук 2-5,7 виявило, що найбільш перспективним нейротропним агентом є сполука 2. Метильна група у сполуці 3 приводить до послаблення анальгетичної та антиконвульсивної активності у порівнянні зі сполукою 2. Сполуки 2-5 виявили також антигіпоксичну активність.

Таким чином, аналіз співвідношення структурних особливостей та фармакологічної активності похідних ендикового ангідриду є важливим для оптимізації шляхів пошуку ефективних та практично корисних сполук.