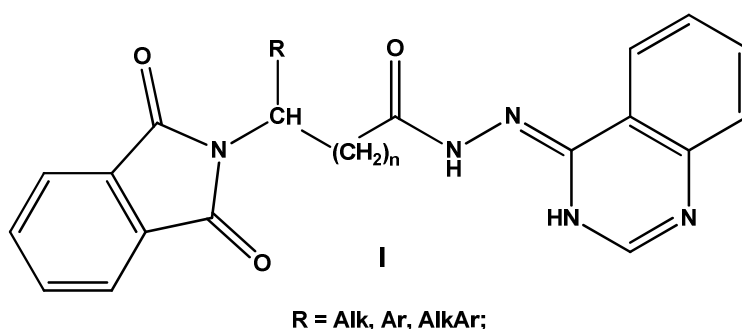


(1,3-ДИОКСОІЗОІНДОЛІЛ-1)АЛКІЛ-(АЛКАРИЛ, АРИЛ) КАРБОНОВІ КИСЛОТИ З ГІДРАЗИНОХІАЗОЛІНОВИМ ФРАГМЕНТОМ: СИНТЕЗ ТА ПРОТИМІКРОБНА АКТИВНІСТЬ

Мартиненко Ю.В., Ребець О.Л., Казунін М.С., Коваленко С.І.
Запорізький державний медичний університет, м. Запоріжжя,
Запорізька обласна клінічна лікарня, м. Запоріжжя

Сучасна стратегія спрямованого синтезу потенційних лікарських засобів передбачає вибір базового структурного блоку (матриці) для пошуку високоактивних молекул. В цьому плані, на нашу думку, привертають увагу похідні карбонових кислот з ізоіндольним та хіназоліновим фрагментами як сполуки, що мають дуже широкий спектр фармакологічної дії (антибактеріальну, протипухлинну, антиоксидантну та інші).

Синтез вихідних молекул проводили взаємодією фталевого ангідриду з амінокислотами у середовищі ацетатної кислоти. При цьому утворюється похідне амінокислоти з заблокованою аліфатичною аміногрупою. Введення хіназолінового фрагмента в карбоксигрупу здійснювалось за допомогою карбонілдіімідазолу (CDI). Імідазолід карбонової кислоти, що утворюється, реагує з гідразинохіназоліном у середовищі апротонного розчинника (діоксану) з утворенням відповідного гідразиду (I):



Будову синтезованих сполук підтверджено за допомогою даних ЯМР ^1H та масс-спектроскопії.

Вивчення антимікробної активності проводили диско-дифузійним методом на середовищі Мюлера-Хінтона на наступних штаммах мікроорганізмів: грампозитивні коки, грамнегативні палички та факультативно анаеробні грамнегативні палички. Первинний фармакологічний скринінг отриманих гідразидів, показав наявність у них помірної антимікробної дії. Встановлені певні закономірності будова-дія. Синтезовані сполуки представляють інтерес для подальшого вивчення інших видів біологічної дії.