

Синтез, строение арилсалицилами́дов, обладающих антигельминтной активностью

© Севбо Дмитрий Петрович, Малахова Анна Юрьевна
и Куклин*⁺ Владимир Николаевич

Кафедра фармацевтической химии. Санкт-Петербургская химико-фармацевтическая академия.
ул. Проф. Попова, д.14, Лит. А. г. Санкт-Петербург, 197376. Россия.
Тел.: (812) 234-13-59, (812) 499-39-00 доб. 4080. E-mail: kuklin-prof@yandex.ru

*Ведущий направление; ⁺Поддерживающий переписку

Ключевые слова: арилсалилами́ды, способы получения, строение и биологическая активность.

Аннотация

Впервые, синтезировано 11 новых арилсалицилами́дов, обладающих более высокой антигельминтной активностью по сравнению с фенасалом [5-хлор-*N*-(2-хлор-4-ритрофенил)-2-гидроксибензамид], для которых с помощью современных физико-химических методов анализа (ИК, ЯМР спектроскопия, УФ спектрофотометрия и хрома-масс- спектрометрия) доказано их строение, чистота методами хроматографии и подлинность цветными и осадочными реакциями. Разработан технологичный метод синтеза новых ацетоксипроизводных арилсалицилами́дов. Определена их острая токсичность (ЛД₅₀) на белых мышах (самцах) и показано, что вновь синтезированные производные арилсалицилами́дов по классификации Hodge and Sterner относятся к малотоксичным соединениям. Установлена связь антигельминтной активности со строением полученных новых салицилами́дов. Показано, что арилсалицилами́ды, полученные на основе 3,5-дихлорсалициловой кислоты, обладают большей антигельминтной активностью, чем соответствующие бромсодержащие аналоги; замена метильной на алкоксигруппу во фрагменте ароматического амина арилсалицилами́дов приводит к снижению острой токсичности, причем для пропоксипроизводного еще увеличивается и антигельминтная активность.