

Синтез арилсалициламидов, обладающих антигельминтной активностью

© Малахова Анна Юрьевна и Куклин*⁺ Владимир Николаевич
Санкт-Петербургский государственный химико-фармацевтический университет
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: арилсалициламиды, способы получения и биологическая активность.

Аннотация

Салициламиды (*N*-арилзамещенные гидроксibenзамиды): хорошо известные органические соединения с разнообразной биологической активностью, которые первоначально были исследованы как антимикробные и противогрибковые вещества. Салициламиды также нашли применение в качестве антигельминтных или моллюскоцидных средств в медицине и ветеринарии. Наиболее известным является 5,2'-дихлор-4'-нитросалициламид (никлозамид, йомезан – Германия), ресинтезированный в СССР под названием фенасал, который эффективен при лечении дифиллоботриоза и гименолепидоза и обладает моллюскоцидными свойствами. Синтезу салициламидов их биологической активности посвящены работы отечественных и зарубежных ученых Ф.С. Михайлицына, Н. Vanden Bosshe, L.M. Scheibel, P. Andreus, G. Bonse и др. Изучением антигельминтной активности салициламидов занимались И.А. Архипов, R. Gonnert, E. Schraufstatter, H. Mrozik и другие. В работах разных авторов показана «связь структура – активность» синтезированных амидов. Установлено, что наличие амидной или тиоамидной связи, замещенных амидах имеет значение для антигельминтной активности. Наличие гидроксильной группы во 2-ом положении ароматического кольца фрагмента кислоты салициламидов является основным условием для проявления активности по отношению к ленточным гельминтам и трематодам. Лучший профиль биологической активности салициламидов был получен путем введения хлора в различные положения фрагментов кислоты и амина. Ацилирование гидроксильной группы в салициламидах приводит к снижению их токсичности.