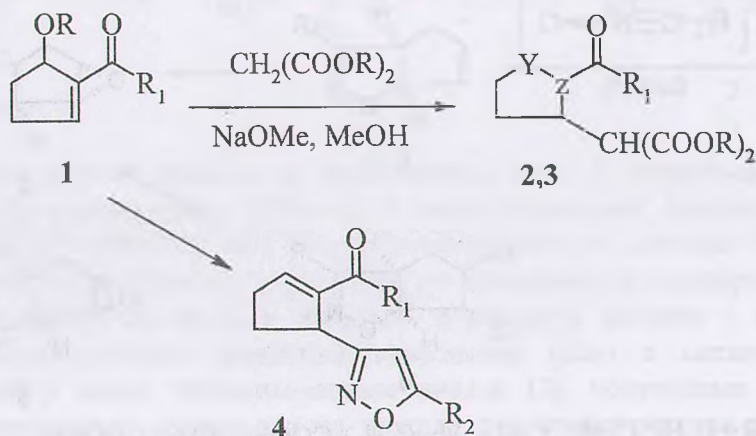


# СИНТЕЗ ПРОСТАНОИДОВ С ФРАГМЕНТОМ МАЛОНОВОГО ЭФИРА В $\omega$ -ЦЕПИ НА ОСНОВЕ 2-АЦИЦИКЛОПЕНТ-2-ЕН-1-ОЛА И ИХ БИОЛОГИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ

И.П.Антоневич, Е.М.Кондратенкова, Н.А.Конопля, А.Е.Машкович, Н.А.Мизуло

Институт биоорганической химии Национальной Академии наук Беларуси  
220141, Минск, ул. акад. Купревича, 5/2

Ранее в качестве простанаидных синтонов нами были получены 2-ацилциклопент-2-ен-1-олы (1) [1]. Формирование в синтонах (1) второй боковой цепи ПГ возможно различными методами, в том числе - присоединением по Михаэлю натриймалонового эфира. При этом непосредственно в условиях реакции происходило элиминирование как свободной, так и защищенной гидроксильной группы с образованием еноновых аддуктов (2). Для изучения зависимости биологической активности от наличия в молекуле различных структурных фрагментов были синтезированы насыщенные аналоги (3) каталитическим гидрированием аддуктов (2), а также простанаиды (4) - изоксазольным методом из енонов (1).



$\text{R}_1 = (\text{CH}_2)_n\text{X}$ ;  $\text{X} = \text{CH}_3, \text{OOMe}$ ;  $n = 4, 6$ ;  $\text{Y, Z} = \text{C}=\text{C}$  (2),  $\text{CH}_2\text{CH}_2$  (3);  $\text{R}_2 = (\text{CH}_2)_4\text{CH}_3$ .

Синтезированные простанаиды (0,5-2,5 мкг/кг) уменьшают на 30-65% повреждающее действие индометацина, аспирина, этанола, соляной кислоты на эпителиальные клетки желудка крыс Вистар, морских свинок и мышей СЗН и не оказывают заметного влияния на продукцию антителообразующих клеток в селезенке иммунизированных мышей СВА. При увеличении дозы (10-20 мкг/кг) эти соединения снижают на 40-50% базальную желудочную секрецию и проявляют иммунодепрессивное действие.

[1] Лахвич Ф.А., Хрипач В.А., Антоневич И.П., Янкова Т.В., Королева Е.В. // Химия гетероцикл. соед. - 1988. - № 7. - С. 966-971.