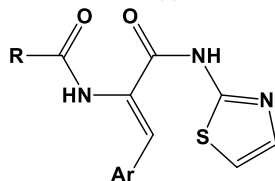


методу Эльмана [9]. Полученные результаты приведены в табл. 1 и 2. Согласно полученным данным (табл. 1) амиды **1-12** в зависимости от структурных изменений в концентрации 8×10^{-5} М ингибируют АХЭ на 54-98%, а БуХЭ – на 75-98%. В этом ряду сравнительно высокую активность по отношению к АХЭ проявляет (Z)-N-(3-оксо-1-фенил-3-(тиазол-2-иламино)проп-1-ен-2-ил)бензамид (**1**, 98%). В случае БуХЭ сравнительно высокий процент ингибирования наблюдается у (Z)-N-(1-(4-бромфенил)-3-оксо-3-(тиазол-2-иламино)-проп-1-ен-2-ил)-4-метоксибензамида (**5**).

Таблица 1

Антихолинэстеразные свойства амидов 1-11 в концентрации 8×10^{-5} М

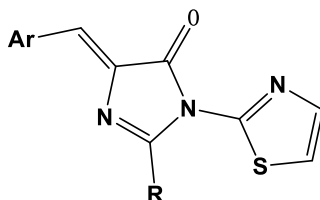


No	R	Ar	Ингибирование, %	
			АХЭ (А)	БуХЭ (Б)
1	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	98,2	95,9
2	C ₆ H ₅	C ₆ H ₄ OMe-4	95,5	75,0
3	C ₆ H ₅	C ₆ H ₄ Cl-4	74,7	95,1
4	C ₆ H ₅	C ₆ H ₃ O ₂ CH ₂ -3,4	54,2	95,8
5	4-MeOC ₆ H ₄	C ₆ H ₄ Br-4	96,8	98,2
6	2-MeOC ₆ H ₄	C ₆ H ₄ Br-4	74,4	94,6
7	4-BrC ₆ H ₄	C ₆ H ₅	64,3	91,7
8	3-BrC ₆ H ₄	C ₆ H ₄ OMe	73,4	79,2
9	4-i-BuOC ₆ H ₄	C ₆ H ₄ Cl-4	97,0	97,1
10	4-AcNHC ₆ H ₄	C ₆ H ₅	96,6	97,5
11	C ₄ H ₄ O*	C ₆ H ₅	80,5	89,1
12	C ₄ H ₄ O*	C ₆ H ₄ NO ₂ -3	97,4	96,4
	2-аминотиазол		74,1	96,0

*Фурил

Таблица 2

Антихолинэстеразные свойства 5-имидазолонов 12-20
в концентрации $8 \times 10^{-5} \text{M}$



No	R	Ar	Ингибирование, %	
			АХЭ (А)	БуХЭ (Б)
13	C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	94,8	82,6
14	C ₆ H ₅	C ₆ H ₄ OMe-4	74,7	85,4
15	C ₆ H ₅	C ₆ H ₄ NO ₂ -3	85,7	81,1
16	C ₆ H ₅	C ₆ H ₄ Br-4	44,9	67,3
17	4-MeOC ₆ H ₄	C ₆ H ₅	95,5	90,1
18	4-MeOC ₆ H ₄	C ₆ H ₄ Br-4	71,5	73,5
19	4-BrC ₆ H ₄	C ₆ H ₅	86,2	89,5
20	4-AcNHC ₆ H ₄	C ₆ H ₅	85,7	96,3

Последний по ингибирующим свойствам превосходит 2-аминотиазол.

В ряду 5-имидазолонов **13-20** в концентрации $8 \times 10^{-5} \text{M}$ сравнительно высокую ингибирующую активность по отношению к обоим ферментам проявляет (Z)-5-бензилиден-2-(4-метоксифенил)-3-(тиазол-2-ил)-3,5-дигидро-4Н-имидазол-4-он (**17**).

Надо отметить, что большинство из исследованных соединений (**1-3, 5,6, 8-15, 17,20**) по своим ингибирующим свойствам по отношению к АХЭ превосходят 2-аминотиазол, тогда как в случае БуХЭ только представители амидов – соединения **5,9,10,12** проявили антибутирилхолинэстеразную активность, превосходящую 2-аминотиазол.

При сравнении антихолинэстеразной активности соединений **1,2,6, 7,10** с **13,14, 18-20** можно заключить, что циклизация амидов α,β -дегидроаминокислот **1,2,6,7,10** в соответствующие 5-имидазолы **13,14, 18-20** приводит к уменьшению антихолинэстеразных свойств. Анало-

гичный результат наблюдается также при замене N-бензоильной группы амида **1** на N-фуорильную (см. соединение **11**).

По методу [10] исследованы также антирадикальные свойства амидов **4**, **9** и 5-имидазолонов **13-15**, **19**. Установлено, что все исследованные соединения лишены антирадикальных свойств.

Научно-технологический центр органической
и фармацевтической химии НАН РА
e-mail: armenarami@gmail.com

**А. А. Оганнесян, Н. А. Оганнесян, С. Р. Тосунян,
член-корреспондент НАН РА В. О. Топузян**

**Исследование антихолинэстеразных свойств
(Z)-N-(3-оксо-1-арил-3-(тиазол-2-иламино)проп-1-эн-2-
ил)ариламидов и (Z)-5-арилден-2-(арил)-3-(тиазол-2-ил)-3,5-
дигидро-4Н-имидазол-4-онов**

Исследованы антихолинэстеразные свойства ряда амидов N-замещенных α,β -дегидроаминокислот и 5-имидазолонов, содержащих остатки 2-аминотиазола по отношению как к ацетилхолинэстеразе, так и к бутирилхолинэстеразе. Установлено, что амиды α,β -дегидроаминокислот по ингибирующим свойствам в основном превосходят соответствующие 5-имидазолы. В ряду амидов α,β -дегидроаминокислот найдены соединения, по антихолинэстеразным свойствам превосходящие 2-аминотиазол.

**Ս. Ա. Հովհաննիսյան, Ն. Ա. Հովհաննիսյան, Ս. Ռ. Թոսունյան,
ՀՀ ԳԱԱ թղթակից անդամ Վ. Օ. Թոփուզյան**

**(Z)-N-(3-օքսո-1-արիլ-3-(թիազոլ-2-իլամինո)պրոպ-1-են-2-իլ)արիլամիդների և
(Z)-5-արիլիդեն-2-(արիլ)-3-(թիազոլ-2-իլ)-3,5-դիհիդրո-4Н-իմիդազոլ-4-ոնների
հակախոլինէստերազային հատկությունների ուսումնասիրություն**

Ուսումնասիրվել են մի շարք 2-ամինոթիազոլի մնացորդ պարունակող α,β -դեհիդրո- ամինաթթուների ամիդների և 5-իմիդազոլոնների հակախոլինէստերազային հատկությունները ինչպես ացետիլ-, այնպես էլ բուրբիրիլխոլինէստերազների հանդեպ: Պարզվել է, որ իրենց արգելակիչ հատկություններով α,β -դեհիդրոամինաթթուների ամիդները հիմնականում գերազանցում են համապատասխան 5-իմիդազոլոններին: Գտնված են միացություններ, որոնք իրենց հակախոլինէստերազային հատկություններով գերազանցում են 2-ամինոթիազոլը:

**A. A. Hovhannisyán, N. A. Hovhannisyán, S. R. Tosunyan,
corresponding member of NAS RA V. O. Topuzyan**

**Investigation Anticholinesterase Properties of
(Z)-N-(3-oxo-1-aryl-3-(thiazol-2-ylamino)prop-1-en-2-yl)arylamides and
(Z)-5-arylidene-2-(aryl)-3-(thiazole-2-yl)-3,5-dihydro-4H-imidazol-4-ones**

Anicholinesterase properties of a number of amides of N-substituted α,β -dehydroaminoacids and 5-imidazolones containing 2-aminothiazole residues with respect to both acetylcholinesterase and butyrylcholinesterase were studied. It was found that the inhibitory properties of amides of α, β -dehydroaminoacids are mainly superior to those of 5-imidazolones. In a number of amides of α,β -dehydroaminoacids, compounds with anticholinesterase properties superior to 2-aminothiazole were found.

Литература

1. *Hussein A. H. M., Khames A. A., Al-Adasy A.-B. A. et al.* – RCC Adv. 2020. V. 10. P. 29723-29736.
2. *Jadav S. S., Badavath V. N., Ganesan R. et al.* – Anti-Infective Agents. 2020. V. 18. P. 101-108.
3. *Марышева В. В., Шабанов П. Д.* – Экспериментальная и клиническая фармакология. 2005. Т. 68. № 1. С. 67-70.
4. *Edwards J. A., Kemski M. M., Rappleye C. A.* – Antimicrob. Agents Chemother. 2013. V. 59. № 9. P. 4349-4359.
5. *Al-Balas Q., Anthony N. G., Al-Jaidi B. et al.* – Plos One. 2009. V. 4. № 5. P.5617.
6. *Volnava N. P., Serebryakov O. G., Makhaeva G. F. et al.* – Biochem. Biophys. 2013. V. 451. P. 209-211.
7. *Топузян В. О., Тосунян С. Р., Пароникян Р. В.* – Хим. ж. Армении. 2012. Т. 65. № 4. С. 519-525.
8. *Тосунян С. Р.* – Хим. ж. Армении. 2013. Т. 66. № 2. С. 316-320.
9. *Ellman G. L., Courtney K. D., Andres V. et al.* – Biochem. Pharm. 1961. V. 7. № 2. P. 88-90.
10. *Топузян В. О., Халатян М. М., Оганнесян А. А. и др.* – Хим. ж. Армении. 2017. Т. 70. № 3. С. 357-367.