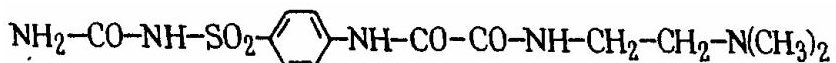


Изобретение относится к области синтеза биологически активных химических соединений, конкретно к  $\beta$ -диметиламиноэтиламиду-4-уреидосульфонилоксаниловой кислоты формулы I



который обладает противовоспалительной и анальгетической активностью.

Целью изобретения является изыскание новых производных уреидосульфонилоксановой кислоты, проявляющих повышенную противовоспалительную и анальгетическую активность и обладающих низкой токсичностью.

Пример.  $\beta$ -Диметиламиноэтиламид-4-уреидосульфонилоксаниловой кислоты (I).

К раствору 3,01г (0,01г-моль) метилового эфира 4-уреидосульфонилоксаниловой кислоты в 15мл этанола прибавляют 1,76г (0,02г-моль)  $\beta$ -диметиламиноэтиламина и оставляют на 12 ч; подкисляют до pH 4. Выделившийся осадок отфильтровывают, сушат. Кристаллизуют из воды. Т.пл. 252°C (разл.). Выход 2,97г (83,1%).

Найдено, %: N 19,42; S 8,78; C 43,5; Z 5,42.

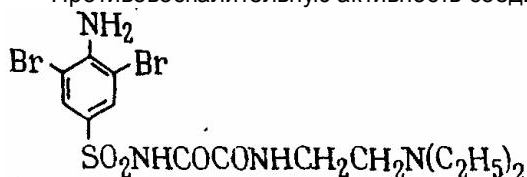
$\text{C}_{13}\text{H}_{19}\text{N}_5\text{O}_5\text{S}$

Вычислено, %: N 19,60; S 8,97; C 43,69; H 5,36.

ИК-спектр,  $\text{cm}^{-1}$ : 3315-3260, 2970-2855, 1685, 1600, 1365, 1160,  $R_f = 0,49$ .

Хроматографическую константу  $R_f$  определяют на пластине "Silufol" в системе растворителей - бутанола, уксусной кислоты и воды (40:10:1) при проявлении парами йода.

Противовоспалительную активность соединения формулы I, а также известного соединения формулы II



определяют на белых мышах массой 15 - 20г. Воспаление вызывают путем впрыскивания в толщу бедра одной из лапок 0,1мл 2,5%-ного раствора формалина. Исследуемое вещество формулы I вводят внутрижелудочно из расчета 102мг/кг массы животного и 116мг/кг массы животного; вещество формулы II - из расчета 162мг/кг; бутадион 100мг/кг (дозы соединений I и II эквимолекулярны ЭД<sub>50</sub> бутадиона 100мг/кг) за 2 ч до инъекции формалина, а затем через 5 и 18 ч после введения флогогенного вещества.

О выраженности антиэкссудативного эффекта исследуемых соединений судят по разности массы воспаленных и невоспаленных лапок опытных групп животных по отношению к контролю.

Анальгетическую активность полученного соединения изучают на белых мышах обоего пола массой 18 - 20г. Ставят 36 опытов. Вещество вводят животным перорально в дозе 51мг/кг, эквимолекулярной ЭД<sub>50</sub> анальгина (50мг/кг). Определение анальгетической активности проводят на модели "уксусных корчей". Для этого через 15 мин после введения исследуемого соединения внутрибрюшинно вводят 3%-ный раствор уксусной кислоты в дозе 300мг/кг.

Противовоспалительная, анальгетическая активность и токсичность соединений приведены в таблице.

Соединение	Доза, мг/кг	Противовоспалительный эффект, %	Анальгезирующий эффект, %	ЛД <sub>50</sub> для меньшей, мг/кг
I	116	39±0,4	77±0,6	8500
II	162	27±0,6	-	4900
Анальгин	50	-	50±0,8	1190

Предложенное соединение обладает повышенной противовоспалительной активностью по сравнению с аналогом по структуре, превышает анальгетическую активность анальгина и проявляет низкую токсичность.