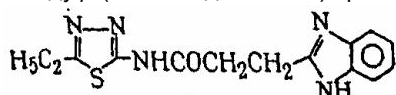


Изобретение относится к новым производным бензимидазола, а именно, к 5-этил-2-(1,3,4-тиадиазолил)-амиду β-(бензимидазолил-2) пропионовой кислоты формулы (1)



проявляющему диуретическую активность.

Цель изобретения - поиск новых соединений в ряду бензимидазола, проявляющих диуретическую активность.

Пример. К раствору 1,36г (0,01 моль) 0-фенилендиамина в 15мл сухого ацетона прибавляют 2,11г (0,01 моль) N-(5-этил-2-1,3,4-тиадиазолил)-сукцинимид. Реакционную массу нагревают в течение 1 ч с обратным холодильником, затем охлаждают, растворитель упаривают. Кристаллизуют из водного диметилформамида (ДМФА), т. пл. 176°C (разложения).

Найдено, %: N 10,78, S 23,39.

C₁₄H₁₅N₅OS

Вычислено, %: N 10,63, S 23,23.

ИК-спектр, см⁻¹: ν_{CO} 1700, 1665, Γ_{NH} 1573, ν_{NH} 3180, 3280, 3360.

Мочегонные свойства указанного соединения определяли на 12 белых мышах массой 18 - 20г, которым вводили вещество в дозе 100мг/кг через рот на фоне водной нагрузки. Объем мочи, выделенной животным за 3 ч служил показателем интенсивности мочеотделения. Полученное количество мочи у мышей как за каждый час, так и за весь опыт, пересчитывали на 10г массы животного. Результаты приведены в таблице.

Соединение	Увеличение диуреза по отношению к контролю, %	LD ₅₀ для мышей при пероральном введении, мг/кг
Предлагаемое	382	5980
6-Хлор-7-сульфамил-3,4-дигидро-2Н-1,2,4-бензотиадин-1,1-диоксид (дихлотиазид)	231	2200

Проведенные исследования показали, что испытанное соединение проявляет высокий диуретический эффект (382%), на 151% превышающий действие дихлотиазида (231%).

Острая токсичность данного соединения на белых мышах при пероральном введении составила 5980мг/кг LD₅₀ дихлотиазида - 2200мг/кг.