

Изобретение относится к области новых биологически активных химических соединений, а именно к моноэтаноламиду N-(6-метоксибензотиазолил-2)-сукциаминовой кислоты, проявляющему гепатозащитную активность.

Указанное свойство позволяет предполагать возможность использования этого соединения в медицине.

Целью изобретения является выявление новых свойств в ряду амидов N-(6-метоксибензотиазолил-2)-сукциаминовой кислоты.

Пример. Получение моноэтаноламида N-(6-метоксибензотиазолил-2)-сукциаминовой кислоты (соединение 1).

К 2,62г (0,01 моль) N-2-(6-метоксибензотиазолил)-сукцинимид в 20мл ацетона прибавляют 0,62г (0,01 моль) моноэтаноламина. Реакционную массу оставляют на 10 ч при комнатной температуре. Осадок отфильтровывают и сушат. Выход 90%. Кристаллизуют из уксусной кислоты. Иглы. Бесцветное кристаллическое вещество, растворимое в ДМФА и ДМСО, т.пл. 203 - 205°C.

Найдено, %: N 12,71 5; S 9,69.

$C_{14}H_{17}N_3O_4$

Вычислено, %: N 12,99; S 9,92.

Данные ИК-спектров, cm^{-1} :

ν_{CO} 16,96, 1652;

δ_{NH} 1571;

ν_{NH} 3378, 3200;

ν_{OH} 3320.

Изучение гепатозащитной активности и острой токсичности моноэтаноламида N-(6-метоксибензотиазолил-2)-сукциаминовой кислоты.

Гепатозащитное действие оценивали по активности аланинаминотрансферазы сыворотки крови (АЛАТ). Гепатозащитную активность исследуемого соединения изучали параллельно с широко применяемым в медицинской практике препаратом "Силибор".

Опыты проводили на 24 крысах-самцах (150 - 200г) на модели поражения печени четыреххлористым углеродом. При этом 18 животным подкожно вводили 50%-ный масляный раствор четыреххлористого углерода из расчета 0,5мл на 100г массы. Из них 6 животным за 1 ч до введения четыреххлористого углерода внутрижелудочно вводили изучаемое соединение в дозе 25мг/кг. В такой же дозе (ЭД₅₀) вводили эталонный гепатозащитный препарат силибор (25мг/кг).

Вторая серия животных получала силибор в дозе 25мг/кг (ЭД₅₀).

Третья серия животных получала только четыреххлористый углерод, вызывавший токсическое поражение печени. Четвертая серия intactных крыс служила контролем. Животных забивали путем декапитации через 24 ч после введения четыреххлористого углерода.

Активность аланинаминотрансферазы сыворотки крови определяли по реакции с 2,4-динитрофенилгидразином. Острую токсичность исследуемого соединения определяли на белых мышах массой 18 - 20г при пероральном введении. Результаты исследований приведены в таблице. Они свидетельствуют о том, что моноэтаноламид N-(6-метоксибензотиазолил-2)-сукциаминовой кислоты на 19% превышает эффект силибора при одинаковой с ним токсичности.

Соединение	Доза	Усиление гепато- защитной функции, %	LD ₅₀ для мышей (мг/кг)
Предлага- емое	25	2 65	6200
Силибор	25	46	6200