

Изобретение относится к биологически активным веществам, конкретно к производному янтарной кислоты общей формулы



проявляющему антиоксидантную активность.

Обладая указанным свойством, синтезированное соединение может найти применение в медицинской практике в качестве антиоксидантного препарата.

Целью изобретения является создание антиоксидантного препарата с низкой токсичностью.

Изобретение иллюстрируется следующими примерами.

Пример 1. К мельчайшей суспензии 2,59г (0,01моль) N-2-(5-фенил-1,3,4-тиадиазолил) сукцинимиды в 30мл сухого ацетона приливают 1,0г (0,01моль) циклогексиламина, перемешивают в течение 30мин при комнатной температуре и оставляют на 5ч. По истечении времени осадок отфильтровывают и сушат. Выход 3,11г (87%), Кристаллизуют из уксусной кислоты и получают желтоватое кристаллическое вещество, хорошо растворимое в растворах щелочей, ДМФА, ДМСО, труднорастворимое в воде, спирте и других органических растворителях.

Найдено, %: N 15,76; S 8,75

$C_{16}H_{22}N_4O_2S$

Вычислено, %: N 15,62; S 8,94

ИК-спектр, cm^{-1} : ν_{CO} 1668; ν_{NH} 3310; ν_{NH} 1553.

Пример 2. Фармакологические исследования проводили на выявление антиоксидантной активности и острой токсичности.

Антиоксидантную активность изучаемого соединения определяли по содержанию конечного, продукта перекисного окисления липидов - малонового диальдегида в гомогенате печени. Опыт проводили на 12 крысах-самцах (120-200г), получавших для усиления липопероксидаций 50%-ный масляный раствор тетрахлорметана (5мл/кг).

При этом за 1ч до введения CCl_4 животным внутрижелудочно вводили исследуемое вещество в дозе, эквивалентной ED_{50} (50мг/кг) α -токоферола ацетата (витамин Е). Через сутки после введения CCl_4 животных декапировали, печень гомогенизировали и определяли в ней содержание малонового диальдегида. Параллельно в аналогичных условиях изучали антиоксидантный эффект витамина Е и аналога. Контролем служили нелеченые, а также интактные животные. Рассчитывали процент угнетения перекисного окисления липидов. Кроме того, была оценена эффективная доза (ED_{50}).

Острую токсичность синтезированного вещества и препаратов-аналогов определяли на белых мышах (18-20г) при пероральном введении.

Полученные результаты (см. таблицу) свидетельствуют о том, что антиоксидантная активность предлагаемого соединения на 55% превышает таковую витамина Е, при этом токсичность соединения согласно изобретению при пероральном введении меньше (6300мг/кг).

Таким образом, предлагаемое соединение представляет интерес для разработки оригинального антиоксидантного препарата.

Соединение	Доза, мг/кг	Процент угнетения перекисного окисления липидов	ED_{50} , мг/кг	LD_{50} для мышей при пероральном введении, мг/кг
Предлагаемое	38	96	7,4	6300
Известное [#]	35	82	17,7	6280
Витамин Е	50	41	84,6	5240