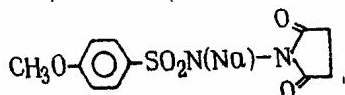


Изобретение относится к области органической химии, а именно к новому химическому соединению, конкретно к N-(4-метоксибензолсульфамидо-)сукцинимиднатрию формулы I



который проявляет анальгезирующую, антиоксидантную и гепатозащитную активность.

Целью изобретения является изыскание новых производных имида янтарной кислоты с низкой токсичностью, обладающих комплексным физиологическим действием: анальгезирующим, антиоксидантным и гепатозащитным.

Пример. N-(4-метоксибензолсульфамидо-)сукцинимиднатрий.

2,84г (0,01 моль) N-(4-метоксибензолсульфамидо-)сукцинимиды растворяют при нагревании в 50мл абсолютного метанола и добавляют раствор метилата натрия, полученный из 0,23г (0,01 моль) металлического натрия и 20мл абсолютного метанола. Реакционную массу оставляют стоять при комнатной температуре в течение 2 ч. Выпавшую соль отфильтровывают, сушат. Выход 2,7г (88%). Т.пл. 268 - 270°C.

Строение предлагаемого соединения подтверждено данными элементного анализа и ИК-спектров (табл.1). Это бесцветное кристаллическое вещество, легко растворимое в воде.

Фармакологические исследования показали, что N-(4-метоксибензолсульфамидо-)сукцинимиднатрий проявляет выраженную анальгезирующую, антиоксидантную и гепатозащитную активность и имеет низкую токсичность. Так, предлагаемое соединение уменьшает порог болевой чувствительности животных на 70% относительно контроля (анальгин - на 47%), т.е. по силе анальгезирующего действия превосходит активность анальгина в 1,5 раза.

По антиоксидантному действию N-(4-метоксибензолсульфамидо-)сукцинимиднатрий превосходит в 1,47 раза активность витамина Б.

Результаты фармакологических исследований свидетельствуют о выраженной гепатозащитной активности предлагаемого соединения, которое уменьшает активность аланинаминотрансферазы (АЛТ) сыворотки крови на 40% (силибор - на 40%), проявляя при этом гепатозащитное действие на уровне силибора.

При определении острой токсичности установлено, что предлагаемое соединение практически нетоксично. При пероральном введении его ЛД₅₀ составляет 6400мг/кг (анальгин - 1911мг/кг, витамин Е - 6250мг/кг, силибор - 5800мг/кг), что в 3,3 раза выше, чем для анальгина, в 1,1 раза выше ЛД₅₀ силибора и близко к токсичности витамина Е.

Результаты фармакологических испытаний на анальгезирующую, антиоксидантную, гепатозащитную активность и острую токсичность представлены в табл. 2.

Таким образом, проведенные исследования свидетельствуют о комплексной фармакологической активности и низкой токсичности предлагаемого соединения.

Т а б л и ц а 1

Выход, %	Т. пл., °С	Найдено, %				Брутто-формула	Вычислено, %				ИК-спектры, см ⁻¹ *		
		С	Н	N	S		С	Н	N	S	ν _{CO}	ν _{SO₂}	ν _{CH₂}
88	268-270	43,20	3,71	9,20	10,67	C ₁₄ H ₁₄ N ₂ O ₅ Na	43,14	3,62	9,15	10,47	1697	1272	2955
											с	1140	2846

* ИК-спектры сняты на приборе UR-20 в таблетках бромида калия (С=0,5%) с призмами из хлорида натрия и фторида лития

Т а б л и ц а 2

Соединение	Уменьшение поро- га болевой чув- ствительности в % относительно контроля в дозе 50 мг/кг	Уменьшение мало- нового диальде- гида в гомогена- те печени в % относительно контроля в дозе 50 мг/кг
I	70	68
Анальгин	47	-
Витамин Е	-	46
Силибор	-	-

	Уменьшение актив- ности АЛТ сыво- ротки крови в % в дозе 25 мг/кг	Острая токсичность в мг/кг при перо- ральном введении (LD ₅₀)
I	40	6400
Анальгин	-	1911
Витамин Е	-	6250
Силибор	40	5800