



(19) **UA** ⁽¹¹⁾ **48 014** ⁽¹³⁾ **A1**
(51)МПК ⁴ **C 07C 143/80 A, A 61K 31/18 B**

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: 4171915, 04.01.1987

(24) Дата начала действия патента: 15.08.2002

(46) Дата публикации: 15.08.2002

(72) Изобретатель:

Банний Иван Прокопьевич, UA,
Черных Валентин Петрович, UA,
Дроговоз Светлана Мефодиевна, UA,
Дейнека Галина Кузьминична, UA,
Савченко Виктор Николаевич, UA,
Зупанец Игорь Альбертович, UA

(73) Патентовладелец:

Национальная фармацевтическая академия
Украины, UA

(54) β -ФЕНИЛЭТИЛАМИДЫ 4-(R-БЕНЗАМИДО)-БЕНЗОЛСУЛЬФОНИЛОКСАМИНОВЫХ КИСЛОТ,
ОБЛАДАЮЩИЕ АНТИАЛЛЕРГИЧЕСКОЙ И АНАЛЬГЕТИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТЬЮ

(57) Реферат:

Изобретение касается производных сульфокислот, в частности β -фенилэтиламидов 4-(R-бензамидо)-бензолсульфонилоксиаминовых кислот, где R - водород, 4-метил или 2-метокси-группа, проявляющих антиаллергическую и анальгетическую активность, что может быть использовано в медицине. Цель - создание новых более активных и менее токсичных веществ этого класса. Синтез целевых соединений ведут реакцией NaOH, β -фенилэтиламида 4-аминобензолсульфонилоксиаминовой кислоты и соответствующего производного хлорангидрида бензойной кислоты. Выход в % т.л.°С и

брутто-формула, соответственно составляют: а) 84; 218-219; $C_{23}H_{22}N_3O_5S$; б) 80; 234-235; $C_{24}H_{23}N_3O_5S$ в) 81, 212-214; $C_{24}H_{23}N_3O_6S$. Новые соединения имеют степень анальгетической активности 59-63 против 482 для анальгина и антиаллергической активности через 1 ч после введения 42-43 против 31% для димедрола при токсичности 4342-4622 против 267-1197мг/кг для известных соединений.

Официальный бюллетень "Промышленная собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные модели, топографии интегральных микросхем", 2002, N 8, 15.08.2002. Государственный департамент интеллектуальной собственности Министерства образования и науки Украины.

UA
48014
A1

UA
48014
A1



(19) **UA** ⁽¹¹⁾ **48 014** ⁽¹³⁾ **A1**
(51) Int. Cl. ⁴ **C 07C 143/80 A, A 61K 31/18**
B

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF
UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL
PROPERTY

(12) **DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION**

(21), (22) Application: 4171915, 04.01.1987

(24) Effective date for property rights: 15.08.2002

(46) Publication date: 15.08.2002

(72) Inventor:

Bannyl Ivan Prokopovych, UA,
Chernykh Valentyn Petrovych, UA,
Drohovoz Svitlana Mefodilivna, UA,
Delneka Halyna Kuzmivna, UA,
Savchenko Viktor Mykolalovych, UA,
Zupanets Ihor Albertovych, UA

(73) Proprietor:

National Pharmaceutical Academy of Ukraine, UA

(54) **β -PHENYLETHYLAMIDES OF 4-(R-BENZAMIDO)-BENZENESULFONYLOXAMIC ACIDS EXHIBITING ANTIALLERGIC AND ANALGESIC ACTIVITY**

(57) Abstract:

The invention relates to the derivatives of the sulfonic acids, in particular to β -phenylethylamides of 4-(R-benzamido)-benzenesulfonyloxamic acids where R – hydrogen, 4-methyl or 2-methoxy group. The substances exhibit antiallergic and analgesic activity and may be used in medicine. The aim consists in developing more active and less toxic substances of such a group. The end substances are synthesized in a reaction between NaOH, β -phenylethylamide of 4-aminobenzenesulfonyloxamine acid and corresponding derivative of the chloroanhydride of benzoic acid. The yield, the melting point,

and the gross formulae are such as follows: a) 84; 218-219; $C_{23}H_{22}N_3O_5S$; b) 80; 234-235; $C_{24}H_{23}N_3O_5S$ c) 81, 212-214; $C_{24}H_{23}N_3O_6S$. The analgesic activity of the novel substances amounts to 59-63% versus 482% in the case of analgin. The antiallergic activity of the novel substances in 1 h after administration amounts to 42-43% versus 31% in the case of dimedrol. The toxicity is 4342-4622 mg/kg versus 267-1197 mg/kg for known substances.

Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2002, N 8, 15.08.2002. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.

UA
48014
A1

UA
48014
A1



(19) **UA** (11) **48 014** (13) **A1**
(51)МПК⁴ **С 07С 143/80 А, А 61К 31/18 В**

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:
4171915, 04.01.1987

(24) Дата набуття чинності: 15.08.2002

(46) Публікація відомостей про видачу патенту
(деклараційного патенту): 15.08.2002

(72) Винахідник(и):

Банний Іван Прокопович, UA,
Черних Валентин Петрович, UA,
Дроговоз Світлана Мефодіївна, UA,
Дейнека Галина Кузьмівна, UA,
Савченко Віктор Миколайович, UA,
Зупанець Ігор Альбертович, UA

(73) Власник(и):

Національна фармацевтична академія України,
UA

(54) **Ь-ФЕНІЛЕТИЛАМІДИ 4-(R-БЕНЗАМІДО)-БЕНЗОЛСУЛЬФОНІЛОКСАМІНОВИХ КИСЛОТ, ЯКІ
ПРОЯВЛЯЮТЬ АНТИАЛЕРГІЙНУ ТА АНАЛГЕТИЧНУ АКТИВНІСТЬ**

(57) Реферат:

Винахід стосується похідних сульфокислот, зокрема β -фенілетиламідів 4-(R-бензамідо)-бензолсульфонілоксамінових кислот, де R - водень, 4-метил або 2-метокси-група, які проявляють антиалергічну та анальгетичну активність, що може бути використано в медицині. Мета полягає в створенні нових більш активних та менш токсичних речовин зазначеного класу. Цільові сполуки синтезують в реакції між NaOH, β -фенілетиламідів

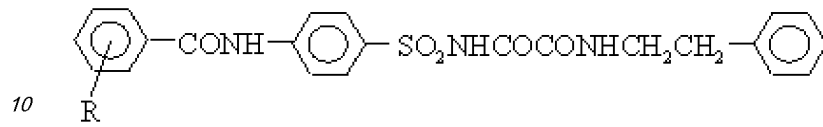
4-амінобензолсульфонілоксамінової кислоти та відповідного похідного хлорангідриду бензойної кислоти. Вихід в % т.пл.°C і брутто-формули відповідно становлять: а) 84; 218-219; C₂₃H₂₂N₃O₅S; б) 80; 234-235; C₂₄H₂₃N₃O₅S в) 81, 212-214; C₂₄H₂₃N₃O₆S. Ступінь анальгетичної активності нових сполук становить 59-63 в порівнянні з 482% для анальгіну і антиалергічної активності через 1 год. після введення 42-43 в порівнянні з 31% для димедролу, в той час як токсичність складає 4342-4622 в порівнянні з 267-1197 мг/кг для відомих сполук.

Для ознайомлення з описом до патенту дивись:

"Описание изобретения к авторскому свидетельству SU № 1420891"

Формула винаходу

5 β -Фенилэтиламыды 4-(R-бензамидо)-бензолсульфонилоксиаминовых кислот формулы



где R - H, 4-CH₃, 2-OCH₃,
проявляющие антиаллергическую и анальгетическую активности.

15 Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2002, N 8, 15.08.2002. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і науки України.

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

U A 4 8 0 1 4 A 1

U A 4 8 0 1 4 A 1