



Государственный комитет
СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ

К АВТОРСКОМУ СВИДЕТЕЛЬСТВУ

(11) 623356

(61) Дополнительное к авт. свид-ву -

(22) Заявлено 02.03.77 (21) 2458613/23-04

с присоединением заявки №-

(23) Приоритет -

Опубликовано 07.09.81. Бюллетень № 33

Дата опубликования описания 07.09.81

(51) М. Кл.³

С 07 С 103/34

А 61 К 31/165

(53) УДК 547.484.

.23.07(088.8)

(72) Авторы
изобретения

Ю.С. Андрейчиков, Г.Д. Плахина, Е.Л. Пидэмский,
Т.Я. Сахарная и Н.В. Голясная

(71) Заявители

Пермский ордена Трудового Красного Знамени государственный
университет им. А.М. Горького и Пермский государственный
фармацевтический институт

(54) ФЕНИЛАМИД β -БРОМБЕНЗОИЛПИРОВИНОГРАДНОЙ
КИСЛОТЫ, ПРОЯВЛЯЮЩИЙ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНУЮ
АКТИВНОСТЬ

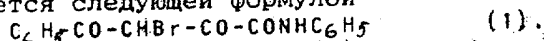
1

Изобретение относится к новым биологически активным соединениям, а именно к фениламиду β -бромбензоилпировиноградной кислоты, проявляющему противовоспалительную активность, который может найти применение в медицине.

Известен амид бензоилпировиноградной кислоты [1], который получают из оксиметилацетофенона, однако противовоспалительной активностью он не обладает.

Целью изобретения является расширение ассортимента средств воздействия на живой организм, в частности соединений с противовоспалительной активностью.

Предлагается фениламид β -бромбензоилпировиноградной кислоты с новой химической структурой, которая выражается следующей формулой



Соединение формулы (1) получают бромированием фениламида бензоилпировиноградной кислоты в среде четыреххлористого углерода при комнатной температуре.

Пример 1. Фениламид β -бромбензоилпировиноградной кислоты.

2

К 1 г (0,0037 моль) фениламида бензоилпировиноградной кислоты, растворенного в 70 мл четыреххлористого углерода, прикапывают раствор 0,29 г (0,0037 моль) брома в 5 мл того же растворителя. Реакционную смесь перемешивают в течение 1 ч, растворитель отгоняют и получают 1,2 г (97,5%) кристаллического вещества белого цвета, т. пл. 166-167°C (из четыреххлористого углерода).

Найдено, %: С 5,70; Н 3,51; Вг 22,94; N 4,20;

$\text{C}_{16}\text{H}_{12}\text{BrNO}_3$

Вычислено, %: С 5,52; Н 3,32; Вг 23,11; N 4,04.

В ИК-спектре полученного соединения присутствуют полосы, см⁻¹: 1735 (валентные колебания амидного карбонила), 1685 (валентные колебания α -карбонила), 1595 (валентные колебания группы NH).

Соединение общей формулы (1) исследуют при внутрибрюшинном введении на белых мышцах (тетрагибриды) и белых крысах (линия Вистар). Для оценки противовоспалительного действия используют модель формалинового воспаления. Величину отека определяют онкометри-

5

10

15

20

25

30

ческим методом А.С.Салюмона (1958) через 3 и 6 ч после введения флогогенного агента. Эталонном сравнения служит фенолбутазон (30 мг/кг). Препарат в дозе 9 мг/кг, что составляет 1/7 от LD₅₀, проявляет противовоспалительную активность (см. таблицу).

Номер соединения	Название	Доза мг/кг	Прирост объема стопы крыс, % к исходному, после введения формалина через	
			3 ч	6 ч
1	Фениламид β-бромбензойлпировиноградной кислоты	7	52,9 р 0,01	45,2 р 0,01
2	Фенилбутазон (бутадон)	30	55 р 0,001	44 р 0,001

Продолжение табл.

Номер соединения	Название	Доза мг/кг	Прирост объема стопы крыс, % к исходному, после введения формалина через		
			3 ч	6 ч	
5					
10	3	Контроль (2%-ная крахмальная связь)	-	69,6	101,9
15	Формула изобретения				
20	Фениламид β-бромбензойлпировиноградной кислоты формулы $C_6H_5-CO-CHBr-CO-CO-NH-C_6H_5$, проявляющий противовоспалительную активность.				
25	Источники информации, принятые во внимание при экспертизе 1. O.Mumm, G.Münchmeier. Превращение оксиметиленацетофенона в бензойлпировиноградную кислоту и ее производные. Ber. 43, 3335-45, 1910.				

Редактор Т.Авдейчик Техред М. Голинка Корректор Е.Рошко

Заказ 6691/60 Тираж 443 Подписное
ВНИИПИ Государственного комитета СССР
по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Филиал ИПП "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4