

94-0142

Rezumat:

Invenția se referă la derivații acidului 2-tienil-oxiacetic, în special la obținerea acizilor 5-[2-(benzensulfonilamino) etil] - sau 5-[2-(4-clorbenzensulfonilamino) etil]-2 tieniloxiacetici care pot fi întrebuințați în medicină pentru tratarea bolilor trombolice.

Scopul constă în crearea substanțelor noi cu activitatea mai sporită din clasa indicată. Sinteza se efectuează prin oxidare, de exemplu, a amidei acidului N-[2-[2-(5-(2-hidroxi)-etoxi)-tienil]-etil]-benzosulfonic cu oxid de argint în mediul acva-bazic. Amida se dizolvă în soluția de KOH sau NaOH cu concentrația 0,5-4n, preferențial de 2n, se oxidează cu 2-16 echivalenți de oxid de argint la temperatura de 75-85 °C timp de 2-3 ore.

Oxidul de argint inițial se obține prealabil prin dizolvarea AgNO_3 în apă distilată și se adaugă cantități echimolare de NaOH. Produsul cu destinație specială se separă în stare liberă sau în formă de sare farmaceutic acceptabilă. Compușii noi sunt puțin toxici și de 4 ori mai activi decât dazoxibenul, începutul acțiunii antitrombinice observându-se la 1 mg/kg și atinge nivelul maxim la 5 mg/kg contra 20 mg/kg.

Revendicări: 4.