

(19) **KG** (11) **1230** (13) **C1** (46) **28.02.2010**

ГОСУДАРСТВЕННАЯ СЛУЖБА
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ

(51) **C07C 51/00** (2009.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к патенту Кыргызской Республики под ответственность заявителя (владельца)

(21) 20080035.1

(22) 31.03.2008

(46) 28.02.2010, Бюл. №2

(76) Зотов Е.П. (KG)

(56) Казимирко В.К., Мальцев В.И. Антиоксидантная система и ее функционирование в организме человека. // Здоров'я України. – 2004. – №98

(54) Применение антиоксиданта «Сиренат» в медицине

(57) Изобретение относится к органической химии и к медицине. Задачей изобретения является увеличение ассортимента водорастворимых антиоксидантов применяемых в медицине. Поставленная цель достигается тем, что натриевая соль 3,5-диметокси-4-гидроксibenзойной, или сиреновой кислоты – «Сиренат», применяется в медицине в качестве водорастворимого ингибитора свободных и перекисных радикалов – антиоксиданта. Хорошая растворимость «Сирената» в воде способствует его быстреей транспортировке к пораженному органу, что имеет немаловажное значение в неотложной ситуации. «Сиренат», как водорастворимый антиоксидант предлагается впервые, что является существенной новизной. Получаемый путем простейшей реакции нейтрализации антиоксидант «Сиренат» может применяться в медицине в качестве антирадикального фактора при многих патологических состояниях.

(21) 20080035.1

(22) 31.03.2008

(46) 28.02.2010, Bull. №2

(76) Zotov E.P. (KG)

(56) Kazimirko V.K., Maltsev V.I., Antioxidative system and its functioning in human organism. // Health of the Ukraine. - 2004. - №98

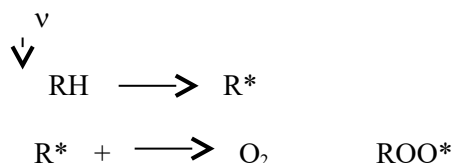
(54) Application of the «Sirenat» antioxidant in medicine

(57) Invention relates to organic chemistry and to medicine. The invention problem is diversification of water-soluble antioxidants, applied in medicine. The object in view is reached by that the 3,5-dimethoxy-4-hydroxybenzoic sodium salt, or purple acid - «Sirenat» is applied in medicine as water-soluble inhibitor of free and peroxide radicals – as an antioxidant. Good solubility of the «Sirenat» in water promotes its fastest transportation to the affected organ that has the large value in urgent situation. «Sirenat» is offered for the first time as a water-soluble antioxidant, what is essential novelty. Received by the elementary reaction of neutralization, the «Sirenat» antioxidant can be applied in medicine as an antiradical factor in multiple pathological state cases.

Изобретение относится к органической химии и медицине.

Известно множество природных и синтетических антиоксидантов – веществ, ингибирующих процессы радикалообразования. Это: эндоантиоксиданты – ферменты супероксиддисмутаза, глутатионпероксидаза, каталаза, адреналин, стероидные гормоны, тироксин и др., экзоантиоксиданты – антоцианы, флавоноиды, галлаты, токоферолы, каротиноиды, ионол, барбитураты и др.

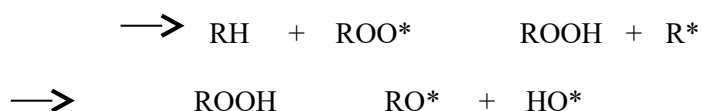
Механизм радикалообразования таков: квант энергии или разрыв межатомной связи



То есть любая молекула органического вещества под воздействием различных радикалообразующих факторов, в норме это естественный метаболизм клеток в организме, преобразуется в свободный или, путем присоединения кислорода, в перекисный радикал, то есть молекулу с неспаренными электронами на внешней орбите и оттого весьма активную.

Особенно много радикалов образуется при радиоактивном и ультрафиолетовом облучении организма, при обширных травмах, отравлениях и особенно тяжелыми металлами, ожогах, психоэмоциональных, часто повторяющихся стрессах и др.

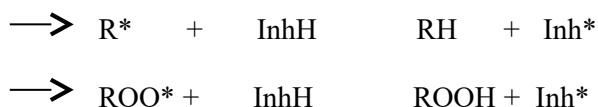
Поскольку реакция радикалообразования имеет цепной характер, так как образующиеся радикалы непрерывно вступают в новые реакции,



количество образующихся радикалов лавинообразно нарастает, защитные силы организма уже не в состоянии нейтрализовать их избыток и радикалы начинают разрушать клетки тканей и органов и ломают всю слаженную работу организма. Это может привести к возникновению таких заболеваний, как: ускорение старения организма, лучевая болезнь, ожоги, гипертоническая болезнь, инфаркты, инсульты, дефицит иммунной системы и рак, дерматиты, катаракта, пародонтит, не считая множества других болезней.

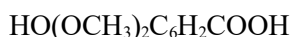
В связи с этим поиск активных антиоксидантов – ингибиторов радикалов, весьма актуален.

Реакция ингибирования состоит в присоединении к радикалу атома водорода антиоксиданта, в силу чего радикал становится неактивным. А ингибитор, антиоксидант, сам становится радикалом, но очень слабым, неспособным продолжать цепную реакцию.



Способностью легко отдавать водород гидроксила обладают, например, производные бензойной кислоты – $\text{C}_6\text{H}_5\text{COOH}$.

Это 3,5-диметокси-4-гидрокси – бензойная или сиреневая кислота:



Механизм ингибирования радикала сиреневой кислотой состоит в том, что находящиеся в о-положении к расположенному в п-положении гидроксилу два метоксила сиреневой кислоты разрыхляют электронное облако гидроксила, связь водорода и кислорода ослабляется, и он легко отдает свой водород радикалу, нейтрализуя его.

Для придания сиреневой кислоте нейтральных свойств (кислота обладает раздражающим действием на живые ткани), производится реакция замещения водорода карбоксильного гидроксила сиреневой кислоты слабой щелочью, например, бикарбонатом натрия:



В результате образуется натриевая соль сиреновой кислоты.

Многие производные бензойной кислоты, например, бензоат натрия, широко применяются в качестве антисептиков при заболеваниях желудочно-кишечного тракта, в качестве консервантов в глазных каплях, в пищевых продуктах на пищевых производствах и при домашнем консервировании, что свидетельствует о полной безвредности этой группы соединений.

Прототипом сущности изобретения выбрана статья Казимирко В.К., Мальцев В.И. Антиоксидантная система и ее функционирование в организме человека. // Здоров'я України. – 2004. – №98.

Задачей изобретения является увеличение ассортимента водорастворимых антиоксидантов применяемых в медицине.

Поставленная цель достигается тем, что натриевая соль 3,5-диметокси-4-гидрокси – бензойной, или сиреновой, кислоты – «Сиренат», применяется в медицине в качестве водорастворимого ингибитора свободных и перекисных радикалов – антиоксиданта.

Сущность изобретения состоит в том, что натриевое производное сиреновой кислоты является активным антиоксидантом, так как очень легко отдает водород гидроксила на нейтрализацию радикала, уменьшая тем самым перекисную окислительную реакцию организма и ее разрушающее действие на клетки тканей и органов. Этим она существенно отличается от других производных сиреновой кислоты и других известных антиоксидантов, например, антоцианов.

Хорошая растворимость вещества в воде способствует его быстрой транспортировке к пораженному органу, что имеет немаловажное значение в неотложных ситуациях. Предлагаемое соединение как водорастворимый антиоксидант может применяться в медицине в качестве антирадикального фактора при многих патологических состояниях, что является существенной новизной.

Получение целевого продукта. В эквимольный раствор сиреновой кислоты добавляется эквимольный раствор натрия бикарбоната до достижения нейтральной реакции, в результате чего образуется водорастворимая натриевая соль сиреновой кислоты – «Сиренат». Целевой продукт представляет собой жидкость без цвета и запаха с рН 7.4.

Радикалообразование протекает не только в водных средах – в протоплазме клеток и в межклеточной жидкости, но и как липотропный процесс – в мембранах клеток и в жидких средах организма. Поэтому комбинированное применение гидрофильного антиоксиданта, каковым является предмет изобретения и липофильного, например, токоферола, создает предпосылку универсального воздействия на клетки и ткани, подвергшиеся процессу перекисной окислительной реакции.

Экономический эффект от применения предлагаемого антиоксиданта складывается из уменьшения времени ингибирования перекисной окислительной реакции в пораженном органе и в организме в целом, что приводит к ускорению выздоровления больного, к уменьшению дней нетрудоспособности по болезни и числа койкодней в стационаре, в экономии медикаментов, а также из экономии времени пациента и врача.

Примеры применения.

Пример 1. Парентеральный способ введения в организм «Сирената» может применяться в неотложных случаях, сопровождающихся массивным радикалообразованием, в частности, при радиоактивном и избыточном ультрафиолетовом облучении, при инфарктах сердца, легких и других органов, при массивных травмах, сопровождающихся разрывом тканей, при обширных ожогах, при тяжелых психо-эмоциональных стрессах.

Пример 2. Применение «Сирената» наружно, в частности, в виде примочек и повязок на свежие и инфицированные раны, а также на ожоговые раны, поскольку и в них имеет место массивное радикалообразование.

Пример 3. Пероральный способ введения «Сирената» может применяться, например, при отравлении радионуклидами, другими токсикантами, особенно солями тяжелых металлов.

Преимущество предлагаемого антиоксиданта «Сиренат» перед другими антиоксидантами состоит в том, что он получается в результате простой реакции нейтрализации сиреновой кислоты слабой щелочью, исходный продукт – 3,5-диметокси-4-гидрокси-бензойная (сиреновая) кислота образуется как побочный продукт при гидролизе лигнина, то есть вполне доступна, соединение может применяться в медицине в качестве активного водорастворимого антиоксиданта, особенно в неотложных случаях, а в комбинации с жирорастворимыми антиоксидантами – как универсальный антиоксидантный комплекс.

Формула изобретения

Применение в медицине натриевой соли 3,5-диметокси-4-гидроксибензойной, или сиреновой кислоты, в качестве антиоксиданта.

Выпущено отделом подготовки материалов

Государственная служба ИС КР, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41; факс: (312) 68 17 03