



(19) KG (11) 2042 (13) C1  
(51) C07C 39/235 (2017.01)  
C07C 39/44 (2017.01)

ГОСУДАРСТВЕННАЯ СЛУЖБА ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ И  
ИННОВАЦИЙ ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ к патенту Кыргызской Республики под ответ-  
ственность заявителя (владельца)**

(21) 20170019.1

(22) 15.02.2017

(46) 28.04.2018, Бюл. № 4

(76) Эрназарова Б. К.; Бакирова А. А.; Бечелова А. Т. (KG)

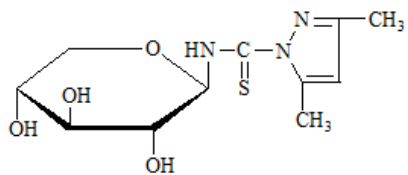
(56) Эрназарова Б. К. Синтез производных гликозилмочевин на основе реакций переамидирова-  
ния нитрозокарбамидов: Дисс. канд. хим. наук: 06.01.04. - Бишкек, 2002. - С. 79-91

**(54) 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметилпиразол для использования в  
медицине**

(57) Изобретение относится к получению нового химического соединения, которое можно  
использовать в медицине.

Задачей изобретения является получение химического соединения углеводного произ-  
водного тиопиразола, которого можно использовать в медицине в качестве лекарственного препа-  
рата.

Поставленная задача предлагаемого изобретения решается получением 1-[N-(β-D-ксилопи-  
ранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметил-пиразола следующей формулы:



для использования в медицине.

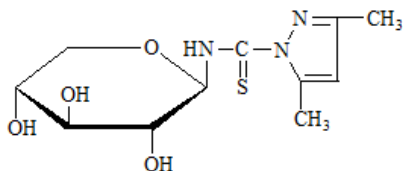
1 н. п. ф., 1 пр.

Изобретение относится к получению нового химического соединения, которое можно  
использовать в медицине.

Ближайшим прототипом является способ получения 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-кар-  
бамоил]-3,5-диметилпиразол], путем взаимодействия 1-(N-β-D-гликопиранозил)-семи-карбазида  
легко взаимодействуют с ацетоуксусным эфиром при непродолжительном нагревании реакцион-  
ной смеси в среде абсолютного метанола с образованием 1-[N-β-D-гликопиранозил)-карбамоил]-  
3,5-метилпира-золона (Эрназарова Б. К. Синтез производных гликозилмочевин на основе реакций  
пере-амидирования нитрозокарбамидов: Дисс. канд. хим. наук: 06.01.04. - Бишкек, 2002. - С. 79-  
91).

Задачей изобретения является получение химического соединения углеводного производно-  
го тиопиразола, которое можно использовать в медицине в качестве лекарственного препарата.

Поставленная задача решается получением 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамо-ил]-3,5-  
диметилпиразола следующей формулы:



для использования в медицине.

Сущность предлагаемого изобретения заключается во взаимодействии 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-карбамоил]-3,5-диметилпиразол с 2,4-бис-(п-метоксифенил)-1,3,2,4-дитиадифосфетан-2,4-дисульфидом (LR), в присутствии абсолютного триэтиламина и углекислого газа приводить к образованию 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-ди-метил-пиразол (I).

В колбу помещают 0,025 г (0,9 ммоль) 1-[(N-β-D-ксилопиранозил)-карбамоил]-3,5-диметилпиразола и 0,035 г (0,08 ммоль) 2,4-бис-(п-метоксифенил)-1,3,2,4-дитиадифосфетан-2,4-дисульфидом (LR), 2 мл абс. тетрагидрофурана и 0,025 мл абс. триэтиламина. Колбу наполняют сухим углекислым газом и кипятят с обратным холодильником и хлоркальциевой трубкой в течение двух часов.

Раствор упаривают под вакуумом при температуре бани 45-50 °С досуха. Остаток перекристаллизовывают из спирта. Выпавшие кристаллы отфильтровывают и высушивают на воздухе.

Выход: 0,0152 г, (58,46 %),

$T_{пл} = 116-116,5$  °С,

$R_f = 0,89$  (система - хлороформ : этанол (3:1)).

Вычислено %: С - 45,98; Н - 5,96;

Н - 14,62; S - 11,15

Найдено %: С - 45,07; Н - 5,13;

Н - 13,70; S - 10,73.

Полученное соединение соответствует химической формуле:  $C_{11}H_{17}N_3O_4S$  с молекулярным весом 287,33368.

В ИК-спектре 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметилпиразола (I) появляется широкая полоса поглощения гидроксильной группы  $3453\text{ см}^{-1}$  и  $3269\text{ см}^{-1}$ . Также наблюдаются деформационные колебания N-H (амид II) в области  $1424\text{ см}^{-1}$ . Наблюдаются колебания характеристических полос поглощения связи C=S в области  $1216\text{ см}^{-1}$ . Характерное поглощение углеводной части молекулы для β-конфигурации наблюдается в области  $909\text{ см}^{-1}$ . Полоса при  $1626\text{ см}^{-1}$  относится к колебаниям связи HC=CH. Это скорее согласуется с циклической структурой пиразольного кольца.

В спектрах Протонного магнитного резонанса (ПМР) данного соединения 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметилпиразола (I) обнаружены сигналы протонов при угле родных атомах углеводной цепи в области  $\delta = 4,81-3,41$  м.д. (5H). Сигнал, принадлежащий NH-протону, связанного с  $C_1$  D-ксилопиранозным остатком, проявляется, при  $\delta = 2,5$  м.д. Протоны гидроксильных групп наблюдаются при  $\delta = 2-2,2$  м.д (3H). Сигналы метильных протонов пиразольного кольца наблюдаются в области 2,79 м.д. в виде уширенного синглета (6H). Кроме того, наблюдается сигнал при  $\delta = 5,9$  м.д., (1H) обусловленный СН-пиразольными протонами.

Пример.

В колбу помещают 0,025 г (0,9 ммоль) 1-[(N-β-D-ксилопиранозил)-карбамоил]-3,5-диметилпиразола и 0,035 г (0,08 ммоль) 2,4-бис-(п-метоксифенил)-1,3,2,4-дитиадифосфетан-2,4-дисульфидом (LR), 2 мл абс. тетрагидрофурана и 0,025 мл абс. триэтиламина. Колбу наполняют сухим углекислым газом и кипятят с обратным холодильником и хлоркальциевой трубкой в течение двух часов. Раствор упаривают под вакуумом при температуре бани 45-50 °С досуха. Остаток перекристаллизовывают из спирта. Полученное соединение является желтого цвета. Выпавшие кристаллы отфильтровывают и высушивают на воздухе.

Выход: 0,0152 г, (58,46 %),

$T_{пл} = 116-116,5$  °С,

$R_f = 0,89$  (система - хлороформ : этанол (3:1)).

Элементный анализ:

Вычислено %: С - 45,98; Н - 5,96;

N - 14,62; S - 11,15

Найдено %: C - 45,07; H - 5,13;

N - 13,70; S - 10,73.

Полученное соединение соответствует химической формуле:  $C_{11}H_{17}N_3O_4S$  с молекулярным весом 287,33368.

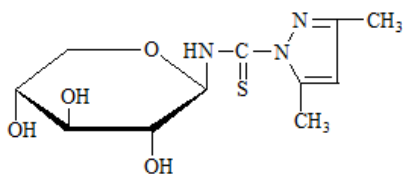
В ИК-спектре 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметилпиразола (I) появляется широкая полоса поглощения гидроксильной группы  $3453\text{ см}^{-1}$  и  $3269\text{ см}^{-1}$ .

Также наблюдаются деформационные колебания N-H (амид II) в области  $1424\text{ см}^{-1}$ . Наблюдаются колебания характеристических полос поглощения связи C=S в области  $1216\text{ см}^{-1}$ . Характерное поглощение углеводной части молекулы для β-конфигурации наблюдается в области  $909\text{ см}^{-1}$ . Полоса при  $1626\text{ см}^{-1}$  относится к колебаниям связи HC=CH. Это скорее согласуется с циклической структурой пиразольного кольца.

В спектрах ПМР данного соединения 1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарбамоил]-3,5-диметилпиразола (I) обнаружены сигналы протонов при углеродных атомах углеводной цепи в области  $\delta=4.81-3.41$  м.д. (5H). Сигнал, принадлежащий NH-протону, связанного с  $C_1$  D-ксилопиранозным остатком, проявляется при  $\delta=2,5$  м.д. Протоны гидроксильных групп наблюдаются при  $\delta=2-2,2$  м.д (3H). Сигналы метильных протонов пиразольного кольца наблюдаются в области 2,79 м.д. в виде уширенного синглета (6H). Кроме того, наблюдается сигнал при  $\delta=5,9$  м.д., (1H) обусловленный CH-пиразольными протонами.

### Формула изобретения

1-[N-(β-D-ксилопиранозил)-тиокарба-моил]-3,5-диметилпиразол, формулы:



для использования в медицине.

Выпущено отделом подготовки материалов

Государственная служба интеллектуальной собственности и инноваций при Правительстве Кыргызской Республики,  
720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41; факс: (312) 68 17 03