

(19) **KG** (11) **862** (13) **C1** (46) 31.03.2006

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО ПО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ (51)⁷ **C07C 213/02; A61K 31/195**
ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к патенту Кыргызской Республики под ответственность заявителя (владельца)

(21) 20040101.1

(22) 08.10.2004

(46) 31.03.2006, Бюл. №3

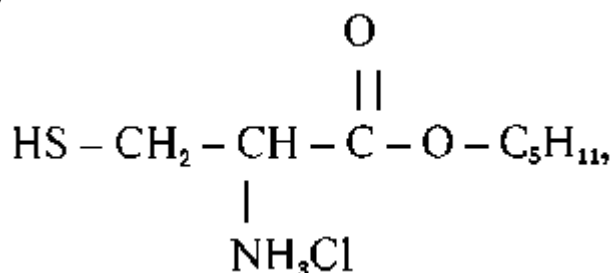
(71)(73) Таласский государственный университет (KG)

(72) Джусупова К.А., Бакасова З.Б., Джумалиева Г.А. (KG)

(56) А.с. SU №879922, кл. C07C 101/22; A61K 31/195, 1980

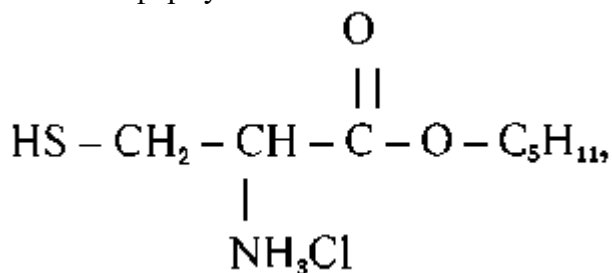
(54) **Амилцистеинат, проявляющий антимикробную активность**

(57) Изобретение относится к новому химическому соединению, которое может найти применение в медицине и ветеринарии. Задачей изобретения является синтез нового соединения, проявляющего антимикробную активность, не характерную для известных аналогов. Сущность изобретения заключается в том, что получают хлоргидрат амилового эфира цистеина формулы:



путем взаимодействия цистеина с абсолютным амиловым спиртом в токе хлористого водорода с последующим добавлением абсолютного эфира при -5 °С. 1 пр., 1 табл.

Изобретение относится к новому химическому соединению, которое может найти применение в медицине и ветеринарии, конкретно к амиловому эфиру цистеина, а именно к хлоргидрату амилцистеината формулы:



проявляющему антимикробную активность.

Известен аналог по назначению - диамилглутамат, проявляющий антимикробные свойства (А.с. SU №879922, кл. C07C 101/22; A61K 31/195, 1980).

Задачей изобретения является синтез нового соединения, проявляющего антимикробную активность, не характерную для известных аналогов.

Задача решается синтезом хлоргидрата амилцистеината путем взаимодействия цистеина с абсолютным амиловым спиртом в токе хлористого водорода с последующим добавлением абсолютного эфира при -5°C .

Пример. К 12.1 г (0.1 моль) цистеина добавляют 50 мл абсолютного амилового спирта и пропускают ток сухого хлористого водорода в течение 5 часов при температуре $138-139^{\circ}\text{C}$. Затем реакционную массу оставляют в течение часа при 25°C и разбавляют 100 мл абсолютного эфира при -5°C . Продукт отфильтровывают и промывают абсолютным эфиром. Выход продукта 19.3 г (85%).

При элементном анализе найдено (%): C - 42.10; H - 7.98; N - 6.2;

рассчитано (%): C - 42.19; H - 7.91; N - 6.16.

Индивидуальность соединения доказана ИК-спектрами.

В ИК-спектрах соединения имеются полосы поглощения в области 1735 см^{-1} ($\text{C}=\text{O}$), 1145 и 1200 см^{-1} ($\text{C}-\text{O}-$), 2580 см^{-1} 2685 см^{-1} (HS); широкая полоса $2600-3000\text{ см}^{-1}$ (NH_3).

Новое соединение соответствует молекулярной формуле $\text{C}_8\text{H}_{18}\text{NO}_2\text{SCl}$. Молекулярная масса 227.5. Соединение белого цвета, без запаха, растворимо в воде. Температура плавления $133-135^{\circ}\text{C}$, удельное вращение $L^{25}_{\text{D}} = 12$ (в ацетоне), удельная масса $d = 1.3315\text{ г/см}^3$.

Хлоргидрат амилцистеинат является физиологически активным препаратом.

При исследовании бактериостатического действия препарата амилцистеината путем разведения препарата на мясопептонном бульоне с инокулятом (1:10, 1:20, 1:40, 1:80, и т.д.) и с последующим высевом культур установлено, что препарат хлоргидрата амилцистеината в разведениях 1:10, 1:20, 1:40, 1:80 задерживает рост тифопаратифозных и дизентерийных палочек, а также синегнойной палочки и цитробактера.

Таблица

Результаты исследования бактерицидных свойств хлоргидрата амилцистеината в сравнении с аналогом (амилглутамат/амилцистеинат)

Испытуемые культуры микроорганизмов	Размеры зон лизиса при разведении				
	1:10	1:20	1:40	1:80	1:160
Salmonella typhi abdom	11/15	8/12	-/9	-/4	-/-
Salmonella typhi murium	9/17	8/15	4/11	4/6	-/-
Paratyphi B.	-/18	-/13	-/10	-/4	-/-
E.Coli 0111	-/22	-/19	-/15	-/10	-/4
E.Coli 0124	-/20	-/18	-/14	-/19	-/13
Shigella Zonnei	14/16	7/14	-/12	-/8	-/3
Shigella Flexneri	-/15	-/10	-/8	-/3	-/-
Pseudomonas aeruginosa	-/26	-/20	-/15	-/7	-/1
Citrobacter	-/25	-/23	-/16	-/7	-/-

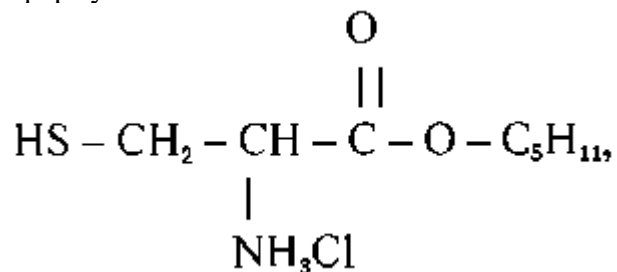
Как видно из таблицы, рост и размножение микробов препарат задерживает в разведениях 1:10 - 1:40. Выраженную антимикробную активность препарат проявляет против E.Coli 0111, E.Coli 0124, Shigella Zonnei.

Таким образом, полученные данные свидетельствуют о том, что препарат

хлоргидрата амилцистеината обладает бактериостатическими и бактерицидными свойствами в отношении вышеперечисленных испытуемых штаммов микроорганизмов. По сравнению с известными структурными аналогами - высшими эфирами метионина, которые обладают фунгицидной активностью, - амилцистеинат проявляет антимикробную активность.

Формула изобретения

Амилцистеинат формулы:



проявляющий антимикробную активность.

Составитель описания
Ответственный за выпуск

Бакеева С.К.
Арипов С.К.

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