



(19) KG (11) 889 (13) C1 (46) 30.08.2006

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО ПО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ ПРИ
ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51) A61K 31/185, 31/325 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к патенту Кыргызской Республики под ответственность заявителя (владельца)

(21) 20050126.1

(22) 23.12.2005

(46) 30.08.2006, Бюл. №8

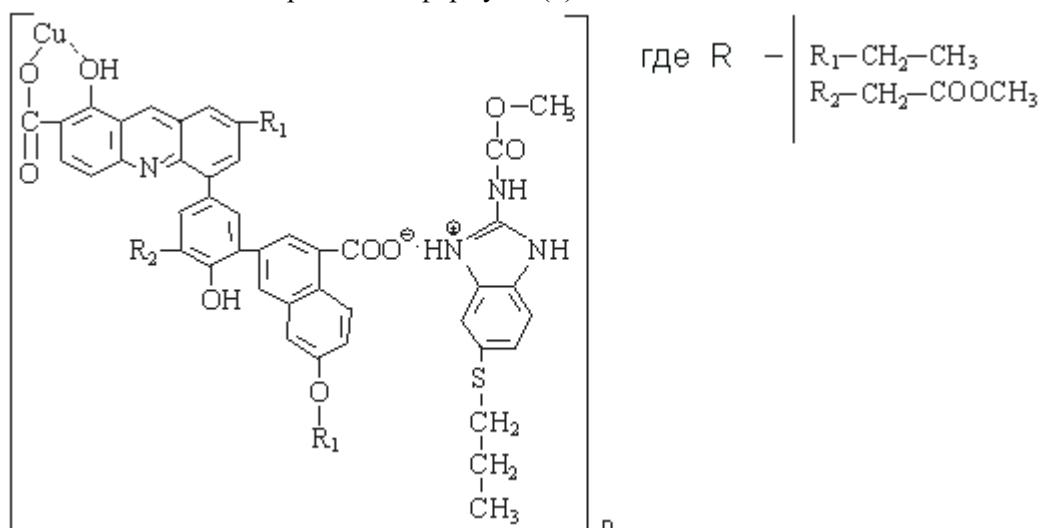
(71)(73) Институт химии и химической технологии НАН КР (KG)

(72) Жоробекова Ш.Ж., Тоимбетов М.Т., Королева Р.П., Арзыбаев М.А., Алыбакова Н.К., Ажибеков Н.А. (KG)

(56) Барчакеев Б.А., Королева Р.П., Стручалина Т.П. Гуминовые кислоты и их значение. – Бишкек: Илим, 2001. – С. 6-25; 40-43; Арзыбаев М. Эффективность сусалина, писульфана и мидизина при мониезиозе овец // Матер. конф. молод. учен. и спец. – Вып. 10. – Бишкек, 2001. – С. 156-159

(54) Комплекс Cu(II) с гуматом и 5-(пропил-тио)-1-n-бензимидазол-2-ил-карбаматом, обладающий антигельминтной активностью

(57) Изобретение относится к области ветеринарии и химии природных, физиологически активных веществ. Задача изобретения – расширение арсенала природных нетоксичных физиологически активных веществ пролонгированного действия, обладающих высокой антигельминтной активностью. Поставленная задача решается синтезом комплекса меди Cu(II) с гуматом и 5(пропилтио)-1-n-бензимидазол-2 ил-карбоматом формулы (1):



где R – |
R₁-CH₂-CH₃
R₂-CH₂-COOCH₃

n = 10-30

Mm = 10000-30000 а.е.м.

обладающий антигельминтной активностью.

1 пр.

(19) KG (11) 889 (13) C1 (46) 30.08.2006

Изобретение относится к области ветеринарии и химии природных физиологически активных веществ.

Комплекс Cu(II) с гуматом и 5-(пропил-тио)-1-n-бензимидазол-2-ил-карбаматом («Альмегум») является биологически активным, обладает высокой антигельминтной активностью и низкой токсичностью.

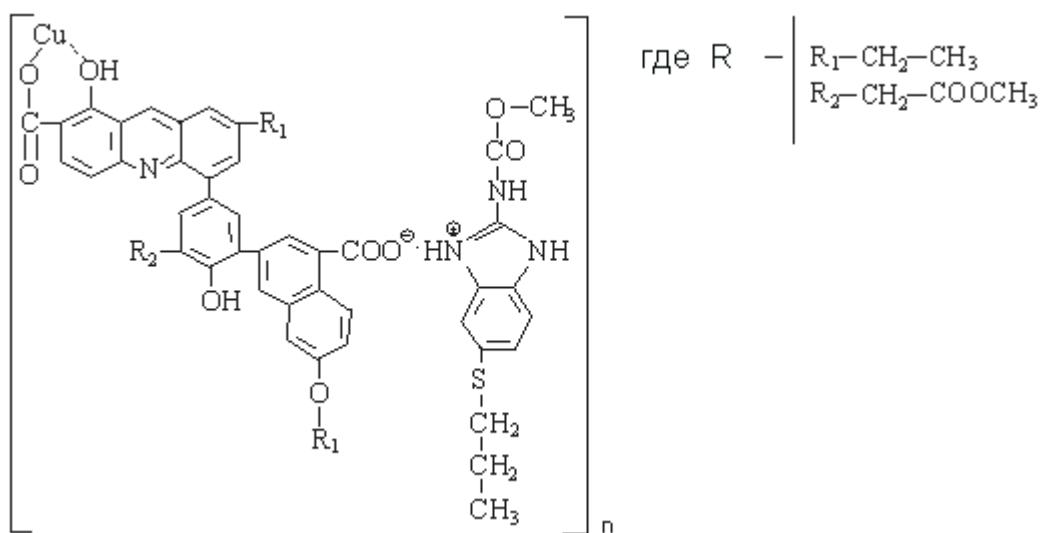
Аналогом «Альмегума» по строению являются гуминовые кислоты, обладающие биологической активностью в отношении грамположительных и грамотрицательных видов бактерий, улучшающие рост и развитие растений, используемые в качестве кормовых добавок в животноводстве и рыбоводстве для увеличения привеса, применяемые в бальнеологии для лечения дерматитов, ревматизма и сердечно-сосудистых заболеваний [Барчакеев Б.А., Королева Р.П., Стручалина Т.П. Гуминовые кислоты и их значение. – Бишкек: Илим, 2001. – С. 6-25, 40-43].

Аналогом изобретения по назначению является препарат «Феналидон», который проявляет антигельминтную эффективность 73.4-87.5% [Арзыбаев М. Эффективность сусалина, писульфана и мидизина при мониезиозе овец // Матер. конф. молод. учен. и спец. – Вып. 10. – Бишкек, 2001. – С. 156-159].

Существенным недостатком «Феналидона» является недостаточная антигельминтная эффективность, высокая себестоимость и проявление побочных действий на желудочно-кишечный тракт.

Задача изобретения – расширение арсенала природных нетоксичных физиологически активных веществ пролонгированного действия, обладающих высокой антигельминтной активностью.

Поставленная задача решается синтезом комплекса меди Cu(II) с гуматом и 5 (пропилтио)-1-n-бензимидазол-2 ил-карбаматом, формулы (1):



n = 10-30

Mm = 10000-30000 а.е.м.

обладающий антигельминтной активностью.

Способ получения нового соединения «Альмегум» приведен в примере.

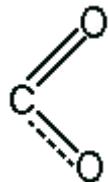
Пример.

К 10 г гумата аммония приливают 300 мл 1%-ного водного раствора альбендазола. Смесь нагревают при температуре 50-60°C, встряхивают или перемешивают до полного растворения осадка. К раствору приливают 150 мл 3.1 м раствора сернокислой меди. Выпавший осадок отфильтровывают, промывают дистиллированной водой и высушивают при температуре 65-70°C. Выход – 95%. Целевой продукт «Альмегум» представляет собой порошок коричневого цвета, без запаха.

Элементный состав:

Найдено, %: C – 61.92; C – 4.37; N – 5.17; S – 3.38; O – 18.66; Cu – 6.50. Вычислено, %: C – 61.66; H – 4.62; N – 5.76; S – 3.29; O – 18.09; Cu – 3.58. Функциональный анализ свободных – OCH₃-групп – 6.40%, карбоксильных – нет, фенольных – 1.75%.

В ИК-спектрах в области 3500-3000 см⁻¹ проявляются валентные колебания полимерных O-H, OH.. ..OH, OH.. ..O = C; в области 2700-2250 и 1690-1640 см⁻¹ – полосы валентных колебаний ν - N⁺H и ν C = N⁺H; в области 1610-1550 и 1410 см⁻¹ асимметричные и симметричные колебания ν_{as} (COO⁻) и ν_s (COO⁻) карбоксигрупп –



при образовании солей, в области 1200-1000 см⁻¹ – валентные колебания ν C – O в фенолах; в области 1380-1355 см⁻¹ – деформационные колебания δ_{C-H} в -CH₂ -CH₃ и -OCH₃- группах.

Определение острой токсичности проводили на 42 клинически здоровых белых мышах живой массой 18-22 г и на таком же количестве белых крыс обоего пола живой массой 60-80 г. Препарат вводили перорально в виде водной суспензии в дозах 500, 700, 900, 1100, 1300 и 1500 мг/кг живой массы с помощью шприца, снабженного металлическим зондом. Контрольные животные получали соответствующий объем физраствора.

Статистическая обработка данных показала, что максимально переносимая доза препарата «Альмегум» для белых мышей составляет 500 мг/кг, среднесмертельная доза ЛД₅₀ – 1005 мг/кг и абсолютна-смертельная доза равна 1500 мг/кг массы тела животного (см. акт испытаний).

Опыты по испытанию антигельминтной активности препарата «Альмегум» проводили на овцах (ягнятах текущего года рождения) в количестве 60 голов обоего пола, спонтанно инвазированных мониезиями, с живой массой в среднем 15 кг.

Отобранные животные были разделены на 6 групп (по принципу аналогов с учетом веса и зараженности) по 10 голов в каждой.

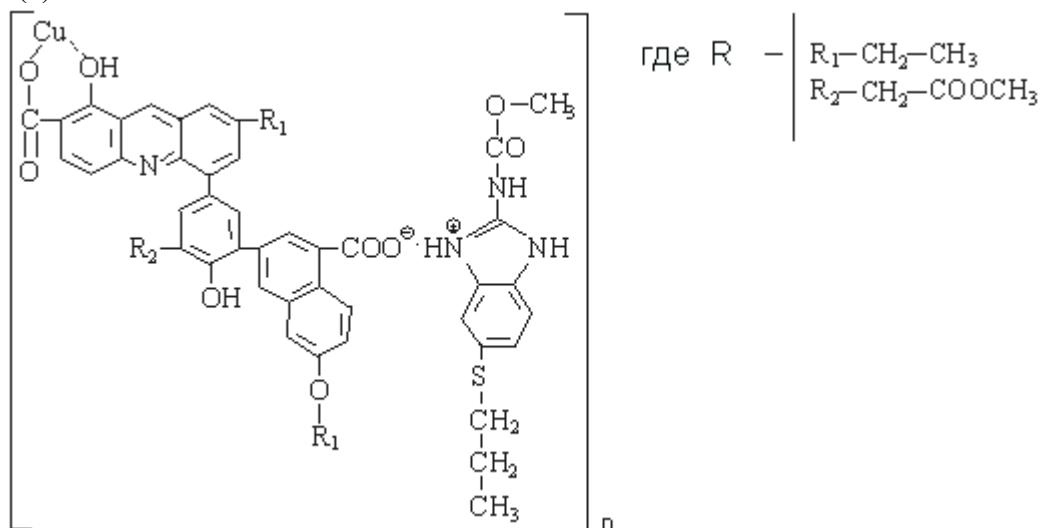
Результаты гельминтологического исследования показали, что в дозах 50 и 75 мг/кг массы животного эффективность препарата «Альмегум» (при переносимой дозе 500 мг/кг живой массы) равнялась 100%, экстенсивная эффективность (ЭЭ) сульфата меди составила 50%, интенсивная эффективность (ИЭ) – 44.4%. ЭЭ и ИЭ феналидона соответственно 87.5 и 73.4%.

Преимуществом заявляемого соединения «Альмегум» является низкая токсичность – до 500 мг/кг и высокая антигельминтная активность – 100%, в то время как активность феналидона составляет 77.8-80%.

Не менее важным преимуществом предлагаемого препарата «Альмегум» является доступность исходного сырья, простота синтеза, высокий выход целевого продукта (95%) и низкая себестоимость.

Формула изобретения

Комплекс меди Cu (II) с гуматом и 5 (пропил-тио-)1-n-бензимидазол-2-ил-карбаматом, формулы (1):



$$n = 10-30$$

обладающий антигельминтной активностью.

Составитель описания

Ответственный за выпуск

Усубакунова З.К.

Арипов С.К.

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