



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **579**

(51) **МПК(2012) C07**
J 9/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения** К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

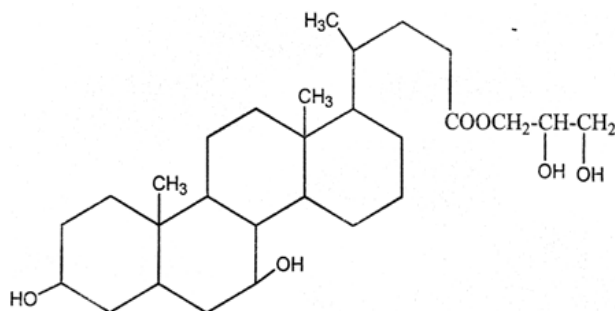
(21) 1300796
(22) 12.07.2013
(46) Бюл.88, 2013
(71) Кодиров А.Х.(ТJ).
(72) Кодиров А.Х.(ТJ); Мироджов Г.К. (ТJ); Назарова З.Д. (ТJ); Султонмамадова М.П. (ТJ); Самандаров Н.Ю. (ТJ); Абдурахимова М.К. (ТJ); Кодиров Ш.А. (ТJ).
(73) Кодиров А.Х.(ТJ).
(54) **ПРОПАН-1,2-ДИОЛОВЫЙ ЭФИР 3 α ,7 β -ДИГИДРОКСИ-ХОЛАНОВОЙ КИСЛОТЫ В КАЧЕСТВЕ ХОЛЕЛИТОЛИТИЧЕСКОЕ И ГИПОХОЛЕСТЕРИНЕМИЧЕСКОЕ СРЕДСТВА** (56) 1. Гребнев А.Л., Геня Л.П. Отдельные результаты холелитической терапии у больных желчно-каменной болезнью препаратами хено- и урсодезоксихолевой кислот. //В журнале клиническая медицина. 1991, №6.-с.63-66.
2. Кадыров А.Х., Хайдаров К.Х., Назарова З.Д. Глицериновый эфир 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, способ его получения и применение в качестве лекарственного средства. //Патент РТ № TJ-237. БЮЛ. №3.(15). 1999г.
Petron M.L. Jazrazi R.P. et al. Ursodeoxycholic acid alone or with chenodeoxycholic acid for

2

dissolution of cholesterol gallstones: a randomized multicentre trial. Aliment. Pharmacol. Ther. 2001. Vol. 15. -p.123-128

(57) Изобретение относится к области синтеза биологически активных химических соединений, проявляющих холелитолитический и гипохолестеринемический свойства.

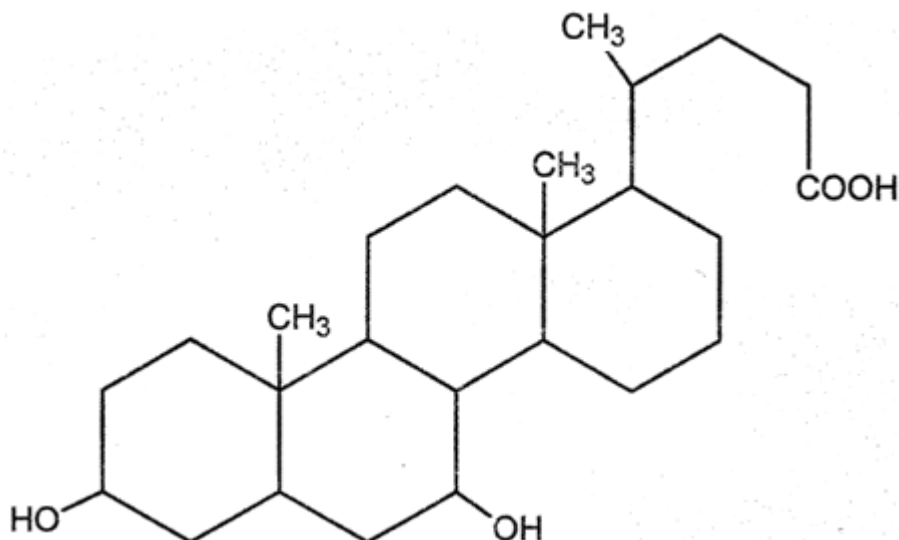
Пропан- 1,2-диоловый эфир 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, формулы:



Изобретение относится к области синтеза биологически активных химических соединений, проявляющих холелитолитический и гипохолестеринемические свойства.

Известно органическое соединение, обладающие желчегонным, холелитолитическим и гипохолестери

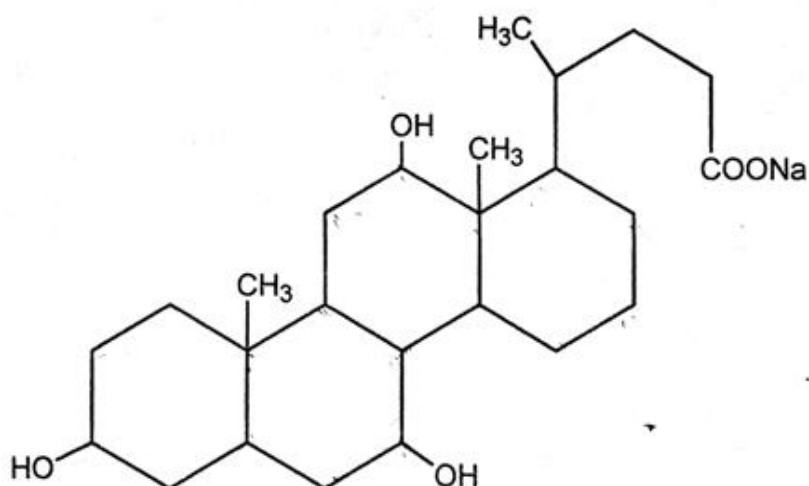
немическим свойствами [1], а именно $3\alpha,7\alpha$ -дигидроксихолановая кислота (хенодезоксиколовая кислота), являющаяся близкой по структуре к новым соединениям, проявляющим холелитолитические действия при желчнокаменной болезни, формулы:



Недостаток указанного аналога заключается в том, что оно менее проявляет холелитические и гипохолестеринемические свойства, а также путь его синтеза не экономично.

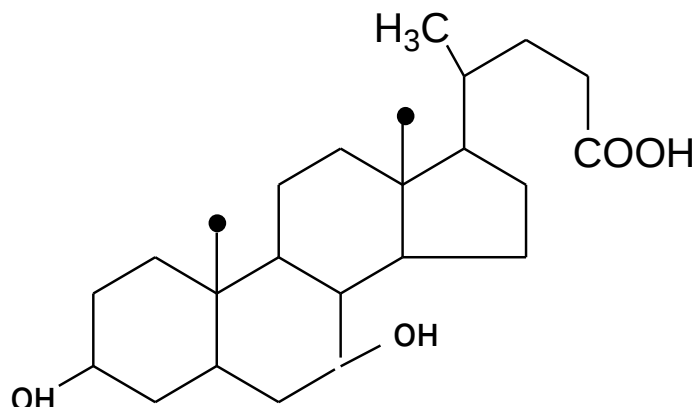
Известна также натриевая соль $3\alpha,7\alpha,12\alpha$ -тригидроксихолановой кислоты, являющаяся холелитолитическим препаратом [2].

Указанное соединение используют как полупродукт для синтеза других холановых кислот, а также в медицинской практике, например, предлагается для дробления холестериновых камней желчного пузыря.



Недостаток этого соединения является то, что оно используется для дробления мелких холестериновых желчных камней, а также имеет длительную продолжительность растворения.

Прототипом является препарат 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты (урсодезоксихолевой кислоты) [3]. Данный препарат используется в медицине в качестве холелитического, желчегонного гипохолестеринемического гепотективного средств.



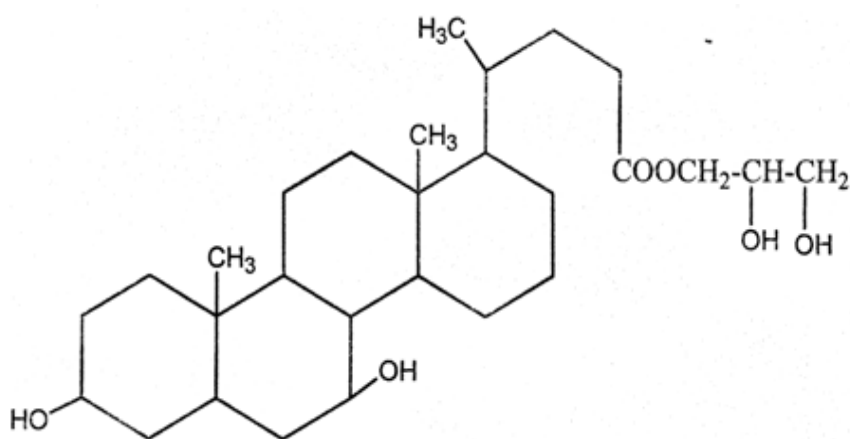
Недостаток препарата заключается в том, что не используется при острых воспалительных заболеваниях желчного пузыря и желчных протоков, а также при его применении не поступает полностью до места назначения, в связи с образованием других производных.

Целью изобретения является получение такого соединения ряда производных 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, которое по сравнению с известными соединениями этого ряда, обладало бы более выраженным холелитолитиче-

ским и гипохолестеринемическим действиями при заболеваниях печени и желчевыводящих путей, будучи в то же время легкодоступным.

Соединение представляет собой новое, неописанное в литературе, производное 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, относящееся к группе стероидов типа холановых кислот.

Таким соединением является пропан-1,2-диоловый эфир 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты формулы:



Это соединение получают в результате реакции замещения при взаимодействии натриевой соли 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты с α монохлоргидрином глицерина в растворе метилового спирта при температуре 60-65 $^{\circ}$ C в течение 5-6 часов.

В круглодонную колбу, присоединенную к обратному холодильнику, помещают 15г (0,036 моль) натриевую соль 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты в 50 мл метанола и добавляют 3,98 г (0,036 моль) α -хлоргидрина глицерина в 10 мл метанола. Реакционную смесь кипятят в течение 6 часов. После чего содержимое колбы отфильтровывают с целью избавления от осадка хло-

рида натрия. Затем после удаления растворителя, остаток полученного пропан-1,2-дионового эфира 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, перекристализовывают из метанола.

Выход: 15,2 г (90%), Т.пл. - 210-211 $^{\circ}$ C

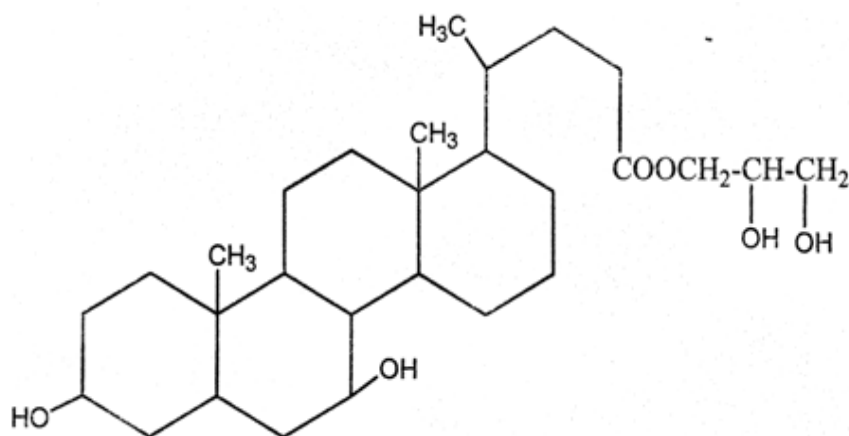
Найдено, в %: С. 69,27., Н. 9,96.

Вычислено для C₂₇H₄₇O₆ %: С. 69,39., Н. 10,05

Структура синтезированного пропан-1,2-дионового эфира 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты подтверждено методами ИК-спектроскопии, а также встречным синтезом путем гидролиза глицидного эфира 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Пропан-1,2-дионовый эфир 3 α ,7 β -дигидроксихолановой кислоты, формулы:



Компьютерный набор: Фатхуллова М.С.

Заказ

Тираж

Подписное

Национальный патентно-информационный центр РТ
734042, г. Душанбе, ул. Айни, 14а.