



Республика Таджикистан

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(19) **TJ** ⁽¹¹⁾ **746**
(51) МПК A61 P33/10

(12) **Описание изобретения**

К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

2

(21) 1500969

(22) 03.07.2015

(46) Бюл. 113, 2015

(71) ТГМУ имени Абуали Ибни Сино и Институт ветеринарии АСХН РТ (ТJ).

(72) Раджабов У. (ТJ); Рахимова Р.Н. (ТJ);

Козихонов А.У.(ТJ); Ёрмамадова С.Г.(ТJ);

Саттори И. (ТJ); Махмудов К.Б. (ТJ);

Сатторов Н. (ТJ); Шарофов С.М. (ТJ).

(73) ТГМУ имени Абуали Ибни Сино и Институт ветеринарии АСХН РТ (ТJ).

**(54) АЛБЦИНКАТ, ПРОЯВЛЯЮЩИЙ
АНТИГЕЛЬМИНТНУЮ АКТИВНОСТЬ.**

(56) 1.Веретенникова Н.Л. Действие альбендазола на мышечной стадии экспериментального трихинеллеза. Материалы докладов научной конференции "Ассоциативные паразитарные болезни, проблемы экологии и терапии", Москва, 5-6 декабря 1995.

2.Кузьмин А.А.//Антигельминтики в ветеринарной медицине. - М.: «АКВАРИУМ ЛТД». 2001-144 с.

3.Машковский М. Д., //Лекарственные средства В 2т. Т.1., Т.2.-М -: ООО «Издательства новая волна» -2004,с. 540 - 608.

(57) Изобретение относится к новым биологически активным химическим веществам, в частности, к синтезу ранее неизвестного соединения альбендазолом цинк(II) сульфат $[ZnAlb]SO_4$, называемое также албцинкат и который может быть использован в ветеринарии в качестве антигельминтного препарата.

Целью изобретения является изыскание новых более эффективных средств, проявляющих антигельминтную активность.

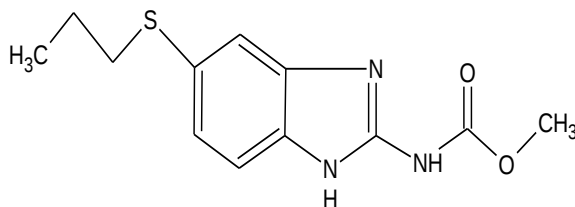
Поставленная цель достигается тем, что применяется новое координационное соединение, албцинкат, который синтезируется взаимодействием сульфата цинка с албендазолом в спиртовом растворе и обладает антигельминтной активностью по отношению гельминтозам животных, вызываемый трематодами, нематодами и цестодами.

Исследование показали, что противогельминтная активность албкупрола по сравнению с контролем на 7-22% выше, а эффективность лечения при желудочно-кишечных заболеваниях животных увеличивается на 97%.

Изобретение относится к новым биологически активным химическим веществам, в частности, к синтезу ранее неизвестного соединения албцинка. Это соединение может быть использовано в ветеринарии в качестве антигельминтного препарата, для лечения

гельминтозов животных, вызываемых трематодами, нематодами и цестодами.

Известен антигельминтный препарат альбендазол ($C_{12}H_{15}N_3O_2S$) метил-5-пропилтио-1Н-бензимидазол-2-илкарбамид [1-2], графическая формула, представлена формулой 1:

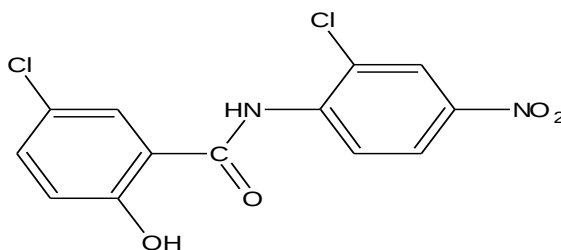


Формула 1. Графическая формула альбендазола

Недостатком этого соединения является слабая антигельминтная активность по отношению к цестодам и другим желудочно-кишечным гельминтами при однократном применении. Для ее активного действия надо использовать несколько раз, но при много-

кратном использовании оказывает токсическое действие на организм животных.

Известен антигельминтик фенасал (phenasalum) - N-2-Хлор-4-нитрофениламид-5-хлор-салициловая кислота, $C_{13}H_8Cl_2N_2O_4$ [3]. Графическая формула этого препарата представлена формулой 2:

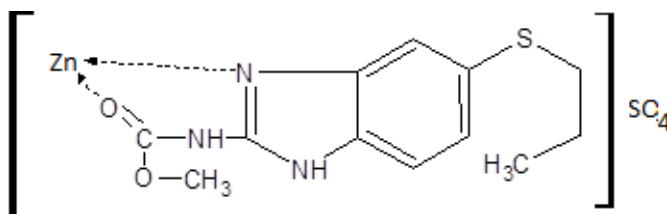


Формула 2. Графическая формула фенасала

Недостатком этого соединения является отсутствием антигельминтным действиям против нематоды и трематоды, т.е. обладает антигельминтного действия только при цестодах, а также высокая стоимость.

Целью изобретения является изыскание новых более эффективных и недорогих средств, проявляющих антигельминтную активность.

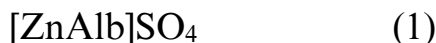
Поставленная цель достигается тем, что применяется новое координационное соединение, албцинкат графическая формула, которого представлена формулой 3 синтезируется взаимодействием сульфата цинка с албендазолом, в 95% этиловом спирте и обладает антигельминтной активностью по отношению к гельминтозным заболеваниям, вызываемых трематодами, нематодами и цестодами.



Формула 3. Графическая формула Альбендазола цинк (II) сульфат

Химическое название албцинката согласно номенклатуре координационных со-

единений ЮПАК - альбендазоло цинк(II) сульфат со следующей общей формулой:



В формуле (1) Alb - обозначение альбендазола. Состав синтезированного соединения в общем виде установлен методами оксрeдметрии, элементного анализа УФ- и ИК – спектроскопией.

Пример 1. Синтез албцинката проводили на кипящей водяной бане. Соотношение сульфата цинка(II) и альбендазола составлял 1:1, где в качестве растворителя использовался 95%-ный этиловый спирт. Навеску альбендазола 13,25 гр. растворяли нагреванием в 100 мл этаноле до образования белой жидкой суспензии. Брали 14,35 гр. навески $\text{ZnSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ измельчали и растворили в 30-35 мл этаноле. После полного растворения $\text{ZnSO}_4 \cdot 7\text{H}_2\text{O}$ в этиловом спирте, полученный раствор смешивали с суспензией альбендазола, и смесь перемешивали стеклянной палочкой. Реакционную колбу на водяной бане нагревали в течении 4 ч до превращения раствора в темно-коричневую густую массу. Затем, полученную массу сливали в фарфоровую чашку, перекристаллизовывали и оставляли на ночь. На следующий день, образующуюся твердую массу измельчали и просушивали на открытом воздухе в течение суток. Затем полученный твердый продукт измельчали в порошок. Выход продукта 96-97% от теоретического.

Пример 2. Исследование по определению токсичности нового соединения проводили в трех сериях на подопытных кроликах породы шиншилла (массой 2,5-2,7кг n=5). В результате опытов установлено, что максимальная переносимая доза (МПД) получаемого состава на кроликов равно $\text{ЛД}_{00}=1\text{г/кг}$, $\text{ЛД}_{50}=1,5\text{г/кг}$, $\text{ЛД}_{100}=3,0\text{г/кг}$.

Внутреннее введение испытуемого соединения кроликам в течение 14 дней в дозе 0,009г/кг живой массы не вызывал каких либо отклонений от физиологической нормы. При патолого-анатомическом вскрытии вынужденно убитых животных макроскопических изменений в паренхиматозных органах мышцах и лимфатических узлах не регистрировали.

Результаты опытов показали, что разработанное соединение безвредно и является мало-

токсичным. При падеже хотя бы одного животного, наличии местной или общей отрицательной реакции проверку проводят на удвоенном количестве животных.

Пример 3. Антигельминтная активность соединения определяли на 54 головах крупного рогатого скота, спонтанно зараженных трематодами и стронгилиями, испытывали препаративную форму албцинката в дозах по ДВ соответственно: 1 группа (5 мг албцинката); 2-ой группе (6 мг албцинката); 3-ей группе (7 мг албцинката). Перед началом опыта были проведены копроовоскопические исследования фекалий по методу Фюллеборна, последовательных промываний и Бермана. Учет антгельминтной эффективности проводили через 25 и 40 дней. Расчет эффективности проводили по типу “критический тест” согласно “Руководству ассоциации ветеринарной паразитологии (1995)”. Эффективность против всех гельминтов составила, соответственно 95-100%.

Пример 4. На 150 овцах, спонтанно зараженных фасциолами, мониезиями и стронгилиями желудочно-кишечного тракта, испытывали препаративную форму препарата путем индивидуальную скармливания. Овец первой группы дегельминтизировали препаратом в дозе 5 мг/кг и 6 мг/кг по ДВ (албцинката), вторую группу - в дозах 6 мг/кг и 7 мг/кг по ДВ. Через 25 дней провели учет эффективности препарата, и он составил в первой группе 99,2% против стронгилят, 100% против мониезий и 99,7% против фасциол, во второй группе - 100% против стронгилят и мониезий и 97,4% - против фасциол.

Пример 5. Терапевтический эффект испытуемого соединения изучали по сравнению с известными антигельминтиками мониезин в форме 10 % суспензии по 1мл/10кг живой массы и 1%-ый раствор медный купорос по 100мл/50кг живой массы на 500 овцах больных диктиокаулезом и мониезизам. Албцинката применяли в форме 22%-ных гранулы, которые вводили животным в дозе 2,0г/ 50кг живой массы. Результаты опытов представлены в табл. 1.

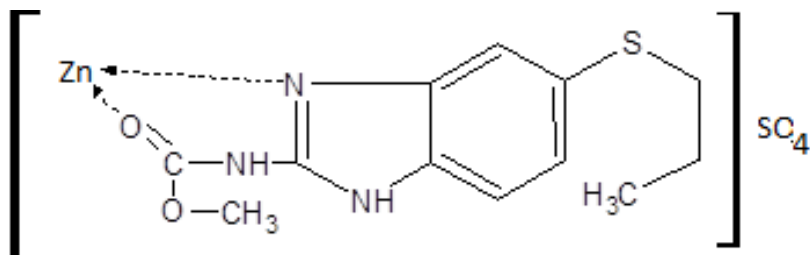
Таблица 1.

Эффективность лечение гельминтозных заболеваний овец

Группы животных	Пробы	Кол-во ж-х, гол	Из них выздоровело	
			голов	%
Опытная	Албцинкат	100	97	97,0
Контрольная	Мониезин	100	97	97,0
Контрольная	Медный купорос 1%	100	75	75,0

Формула изобретения

1. Албендазоло цинк (II) сульфат $[ZnAlb]SO_4$, формулы



обладающий антигельминтную активность.

Компьютерный набор: Фатхуллова М.С.

Заказ

Тираж

Подписное

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