



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **246**

(51)) **МПК(2006) С 07 С 33/04**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения**

К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

(21) 0800220
(22) 27.05.2008
(46) Бюл.55 (3), 2009
(71) Таджикский национальный университет (ТД).
(72) Хабибулаева О. (ТД); Каримов М.Б. (ТД); Ино-
ятова Н.О. (ТД).
(73) Таджикский национальный университет (ТД).
(54) **БУТОПРАНДИОЛ, ОБЛАДАЮЩИЙ АНТИ-
ГЕЛЬМИНТНОЙ АКТИВНОСТЬЮ**
(56) 1. Инструкция «О мероприятиях по предупре-

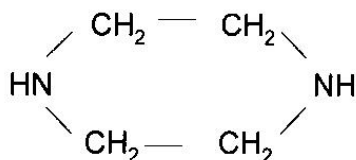
2

ждению и ликвидации заболеваний животных гель-
минтами». Изд. ТСХ СССР. М. 1981 г., с.1-136.
2. Демидов Н.А. «Антигельминтики в ветерин-
рии». Изд. «Колос» 1982г., с.1-365.
3. Известия АН Тадж.ССР. Отделение физи-
ко-математических, химических и геологических
наук, № 2, 1981 г., с. 102.
(57) Изобретение относится к области ветерина-
рии, в частности, применение препарата 1-н-
бутоксипропандиола-2,3 в качестве антигельминтного
средства.

Изобретение относится к области ветеринарии, т. е. применение препарата бутопрандиола (1-н-бутоксипропандиола-2,3) как средство - антигельминтик для борьбы с возбудителями нематодозного заболевания животных.

Известно использование для указанной цели пиперазина ($C_4H_{10}N_2$), фенбендазола (5-фенилтио-2-бензимидазол карбамат). [1], [2].

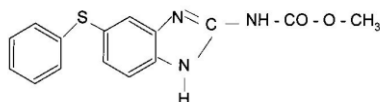
Пиперазин имеет общую формулу



представляет собой бесцветные гигроскопические кристаллы, способные улетучиваться. В свободном виде является сильным основанием, поглощает углекислоту из воздуха, хорошо растворяется в воде (15:100), кристаллизуется из воды в виде гексагидрата ($C_4H_{10}N_2$) $\times$ $6H_2O$. Растворяется в спирте.

Применяется в виде солей - пиперазин адипината, пиперазин сульфата, пиперазин фосфата и гексагидрата. Эти препараты хранятся в стеклянных банках из обычного стекла, а пиперазин гидрат в банках из темного стекла, в сухом месте при комнатной температуре. Препарат получил применение в качестве антигельминтика при аскаридатозах сельскохозяйственных животных и при аскаридозе энтеробиозе человека.

Фенбендазол имеет общую формулу



5-фенилтио-2-бензимидазол карбамат, известен под названием: панакур, HOL-881, аксилур. Представляет собой темножелтый порошок без вкуса и запаха, нерастворимый в воде. Растворяется в демитилсульфаксиде, диметилформамиде, труднее в метаноле, хлороформе, разлагается при температурах 226-230°C. Фенбендазол обладает антигельминтным свойством широкого спектра, эффективен при борьбе с различными видами желудочно-кишечных и легочных нематод, при фасциолезе, мониезиозе. Однако перечисленные препараты не производятся в нашей стране и основным их поставщиком для нужд ветеринарии страны являются иностранные фирмы.

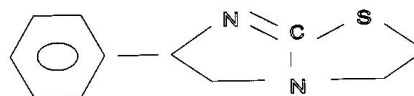
Недостатком этих препаратов является плохая растворимость в воде, из-за чего вскармливание ими животных производится путем смешения сухих порошков с кормом. Это обстоятельство мешает точной дозировке препарата. Его равномерному распределению в массе корма и часто влечет к потере препарата.

Наиболее близким по антигельминтным свойствам является препарат нилверм [1]

Нилверм впервые выпущен английской фирмой YCY как антигельминтик против нематодоз животных. Нилверм известен как: аскаридил, анжелвет, биверм, ветранизол, ветерин-вермизил, декарис C1-50627, красверм, конкунат, мокс, нарпенол, немицид, нилзон, оровермол, пигвормер, спартакон, тетраимизол гидрохлорид, цитарин.

Нилверм представляет собой рацемическую смесь двух изомеров -правовращающего и левовращающего. Левовращающий изомер называется левомизолом, активное действующей частью нилверма.

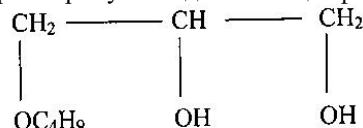
Структурная формула нилверма:



В России нилверм ресинтезирован под названием красверм. Отрицательные качества нилверма: у некоторых животных, индивидуально чувствительных к препарату, отмечается усиление слезотечения, выделения слюны, одышка и рвота.

У крупнорогатого скота и лошадей при подкожном введении на месте укола могут образоваться отеки. Лошадям и крупнорогатому скоту нилверм подкожно нельзя вводить. В нашей стране и странах СНГ используется только импортный препарат для лечения легочных и желудочно-кишечных нематодозов жвачных животных и кур, метастрогилеза свиней, а также для лечения аскаридоза, анкилостоматоза и трихострогилеза человека.

Целью изобретения является применение известного препарата 1-н-бутоксипропандиола-2,3 по новому назначению. 1-н-бутоксипропандиол-2,3 представляет собой бесцветную подвижную жидкость, хорошо растворимую в воде. Его общая формула:



Соединение 1-н-бутоксипропандиол-2,3 не является новым химическим соединением. Сведения, его физико-химические показатели опубликованы ранее [3].

Сущность предлагаемого изобретения заключается в проведении лабораторных исследований препарата 1-н-бутоксипропандиол-2,3 с разными концентрациями (от 0,5 до 100%) в сравнении с известным антигельминтиком нилвермом.

Пример 1. Тест против гельминтов Nippostrongylus brasiliensis в зависимости от концентрации растворов препарата 1-н-бутоксипропандиола-2,3.

До начала опыта подготавливаются рабочие растворы 1-100%-ной концентрации 1-н-бутоксипропандиол-2,3 в дистиллированной воде. В объеме 0,1 мл взвеси гельминтов в физиологическом растворе центрифугированием при 1000-1500

оборотах в течение 5-10 мин и отсасыванием надосадочного слоя добиваются концентрации гельминтов до 50-100 экземпляров.

В 10 ячеек объемом 1-2 мл прозрачной пластмассовой емкости наливают по 0,1 мл взвеси гельминтов. Подопытными служат 9 ячеек, куда добавляют по 0,1 мл растворов испытуемого соединения, а десятая служит контролем -раствор не наливается. Подсчет личинок до и после соприкосновения жидкостей ведут визуальным наблюдением.

Через 2-5, 10-30 мин и 1-12 часов после соприкосновения жидкостей учитывают число мертвых и живых личинок. Но для визуального наблюдения за состоянием жизнеспособности, перед каждым подсчетом мертвых и живых личинок, ячейки со смесью жидкостей подогревают до 37-45°C над электроплиткой или над паром водяной бани, при которой личинки проявляют максимальную подвижность.

Результаты опыта представлены в таблице 1.

Контролем служила взвесь инвазионных личинок гельминта *Nippostrongylus brasiliensis* в физиологическом растворе (0,85%-ный NaCl), которые

были живы в течение 24 часов (срок наблюдения). Обычно эти гельминты в условиях затемнения и при комнатной температуре (18-25°C) в физрастворе сохраняются в течение 2 месяцев и более, т.е. обладают большой жизнеспособностью и весьма устойчивы во внешней среде.

Пример 2. Тест против гельминтов *Nippostrongylus brasiliensis* в зависимости от предельной концентрации действующего начала 1-н-бутоксипропандиола-2,3.

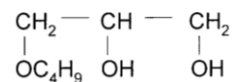
Подготовку и проведение опыта осуществляют как в примере первом, но в ячейки наливают в возрастающих количествах растворов соединения по 0,2-2 мл и добавляют только по 0,2 мл взвеси. Результаты опыта представлены в таблице 2.

Контрольный вариант, как в примере 1.

Приведенные результаты исследований показывают, что предлагаемое соединение является эффективным против гельминтов *Nippostrongylus brasiliensis* и может быть заменителем вышеперечисленных дорогостоящих антигельминтиков.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Применение 1-н-бутоксипропандиола-2,3 общей формулы



в качестве антигельминтика.

Компьютерный набор: Назарова Дж.Д.

Заказ

Тираж

Подписное

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

Таблица 1

N п/п	Концентрация , (%)	Объем взвеси гельминтов (мл)	100%-ная гибель гельминтов от действия препарата (час)
1	1	0,1	120
2	2	0,1	120
3	5	0,1	96
4	10	0,1	72
5	20	0,1	48
6	30	0,1	48
7	40	0,1	24
8	50	0,1	24
9	100	0,1	2

Таблица 2

N п/п	Объем взвеси гельминтов (мл)	Концентрация действующего начала (мл)	100%-ная гибель гельминтов (мин)
1	0,2	0,2	120
2	0,2	0,4	120
3	0,2	0,6	60
4	0,2	0,8	60
5	0,2	1,0	60
6	0,2	1,2	60
7	0,2	1,4	30
8	0,2	1,6	30
9	0,2	1,8	20
10	0,2	2,0	20