



Республика Таджикистан

(19) **TJ** (11) **662**
(51) **МПК(2014)**
C07 G9/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ
ВЕДОМСТВО

(12) Описание изобретения К МАЛОМУ ПАТЕНТУ

1

2

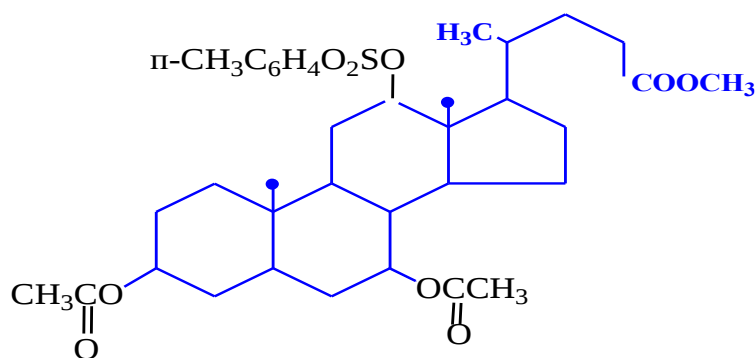
(21) 1400862
(22) 09.06.2014
(46) Бюл. 101, 2014
(71) Кодиров А.Х.(ТJ); Махкамова Б.Х.(ТJ);
Самандаров Н.Ю.(ТJ); Назарова З.Дж.(ТJ);
Кодиров Ш.А.(ТJ); Султонмамадова М.П.(ТJ).
(72) Кодиров А.Х.(ТJ); Махкамова Б.Х.(ТJ);
Самандаров Н.Ю.(ТJ); Назарова З.Дж.(ТJ);
Кодиров Ш.А.(ТJ); Султонмамадова М.П.(ТJ).
(73) Кодиров А.Х.(ТJ); Махкамова Б.Х.(ТJ);
Самандаров Н.Ю.(ТJ); Назарова З.Дж.(ТJ);
Кодиров Ш.А.(ТJ); Султонмамадова М.П.(ТJ).
(54) **12А-ТОЗИЛОКСИЭФИР -3А,
7А-ДИАЦЕТОКСИ 5В –МЕТИЛХО-
ЛАНОВОЙ КИСЛОТЫ В КАЧЕСТВЕ
ПРОТИВОМИКРОБНОГО СРЕДСТВА.**
(56) Соколов В.Н., Маслов М.А., Морозова
Н.Г., Серебренникова Г.А. Синтез поликатион-

ных амфифилов на основе холевой кислоты.
Вестник МИТХТ, 2010, т.5, №6, -с.58-63.

2. А.Х. Кадыров, Г.К. Мироджов, З. Дж., Назарова
Б. Х., Махкамова Н.Ю., Самандаров, М. П., Сул-
тонмамадова, М.К. Абдурахимова, М.П. Султон-
мамадова. 3-хлорбензо (В) тиофен-2-карбокси
гидразид- 3а, 7а гадрозид-12-кетохолановой кис-
лоты, обладающий антибактериальной активнос-
тью. Малый патент РТ № TJ 583.

(57) Изобретение относится к области синтеза
биологически активных химических соединений,
проявляющих антимикробность по отношению к
полевым культурам: стафилококка, нокардии,
пастареллы, коринбактерий,

12а-тозилоксиэфир -3а, 7а-диацетокси метил-
5β –холановой кислоты в качестве противомик-
робного средства имеет формулу:

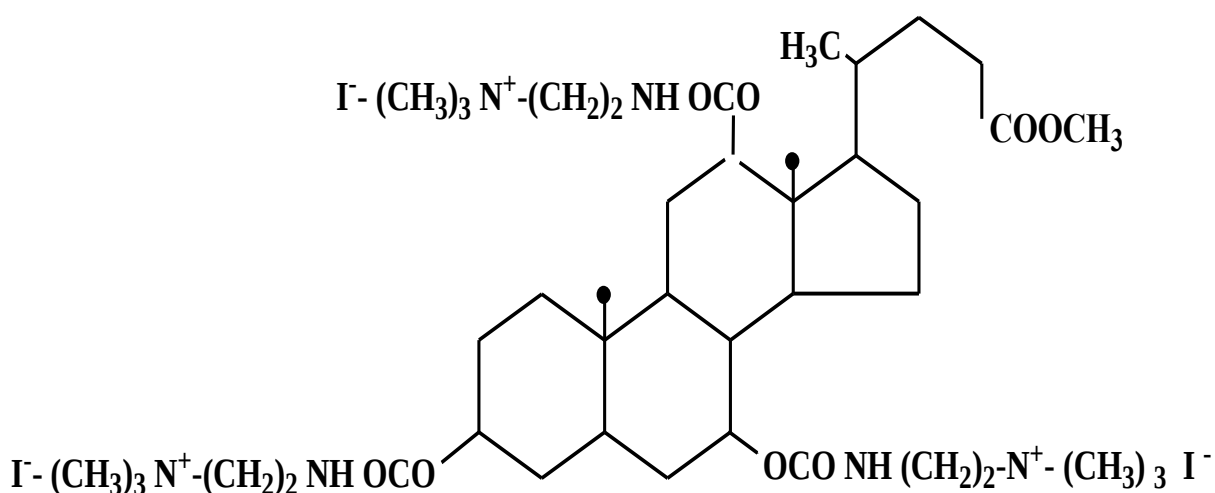


Изобретение относится к области синтеза биологически активных химических соединений, проявляющий антимикробность по отношению к полевым культурам (стафилококк, нокардии, пастареллы, коринбактерии выделенных от животных заболевших респираторными заболеваниями).

Заявляемое соединение представляет собой новое неописанное в литературе, производные, 3 α 7 α -диацето-12 α - гидроксид -5 β -холановой

кислоты, относящиеся к группе стероидов типа холановых кислот.

Известно органическое соединение, проявляющее антимикробные свойства[1]. Метил 3 α , 7 α , 12 α -трис (N,N,N-триметиламиноэтил-карбамоилокси) 5 β -холан -24-оат трийодит; является близко по структуре к новым соединением, проявляющие бактерицидное действие к половым штаммом стафилококка, нокардии, коринбактерии и пастареллы и имеет формулу.

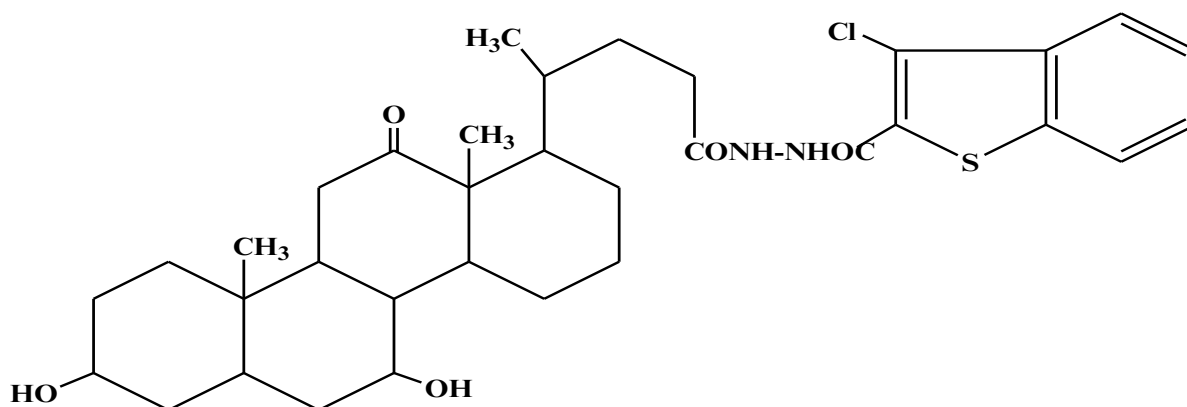


Недостаток заключается в том, что указанное соединение проявляет менее антимикробную активность по отношению к полевым штаммам: стафилококка, нокардии, коринбактерии и пастареллы.

Известно также соединения на примере 3-хлорбензо /в/ тиофен-2-карбокси гидразид- 3 α ,

7 α гидроксид-12-кето-5 β -холановой кислоты, обладающий как бактериостатической, так и бактерицидными активностями [2].

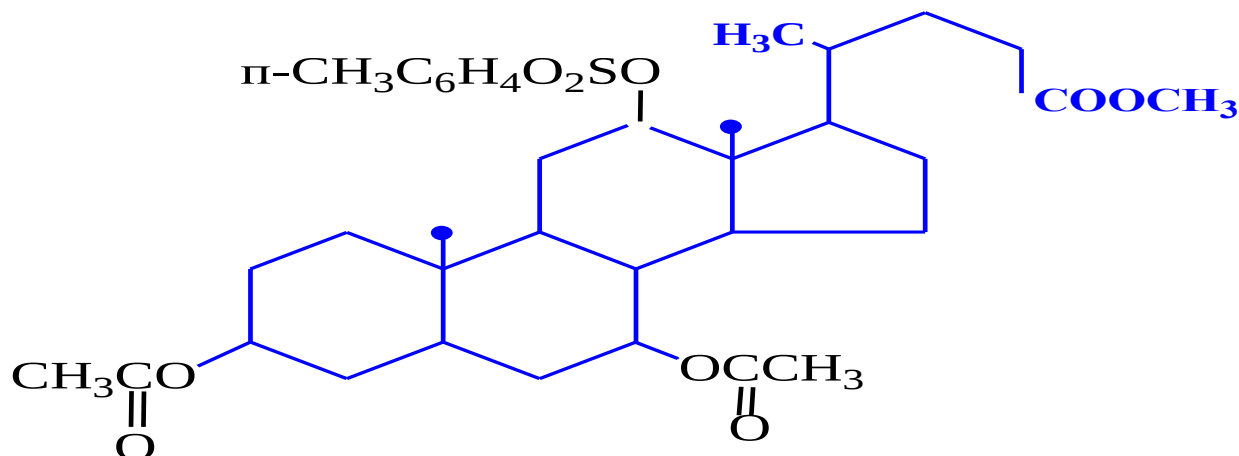
В данном соединении антибактериальное свойство по отношению некоторых половых штаммов, а также путь его химического синтеза является многостадийным, и имеет формулу:



Целью изобретения является получение такого соединения ряда производных 3 α 7 α -диацето-12 α -гидрокси-5 β -холановой кислот, которое по сравнению с известными соединениями этого ряда, обладало бы более антибактериальным ха-

рактером, будучи в то же время гораздо легко синтезируемыми и экономичными.

Поставленная цель достигается получением соединения 12 α -тозилоксиэфира -3 α 7 α -диацетокси-5 β -метилхолановой кислоты.



Данное соединение получают при взаимодействии метилового эфира 3 α 7 α -диацетокси -12 α -гидрокси-5 β -холановой кислоты, с паратолуолсульфо-хлоридом.

Реакцию осуществляют при нагревании исходного вещества, при температуре 70-75 °С в течении 6-часов в среде сухого пиридина.

Пример: В трехгорлую колбу, снабженную механической мешалкой, обратным холодильником и капельной воронкой помещают 5г (0,01моль) метилового эфира 3 α 7 α -диацетокси -12 α -гидрокси-5 β -холановую кислоту и при перемешивании растворяют 15мл сухого пиридина.

После чего при постоянном перемешивании по каплям в течении 5-минут добавляют раствора 1,9г (0,01моль) пара-толуолсульфохлорида в 15мл сухого пиридина. Реакционную смесь при температуре 70-75°С перемешивали в течении 6-часов. По окончании реакции, содержимое колбы вливается в стакан с 150 г льда и выпавший осадок отфильтровывается, промывается водой и высушивается на воздухе, затем перекристаллизуется из этилового спирта.

Выход продукта: 6,0г (89%). Т. пл. 223-224 °С.

Найдено в %: С 65,39; Н 7,93

Вычислено для C₃₆H₅₂O₉S%: С 65,35; Н 7,86.

Преимуществом способа является доступность сырья: 3 α , 7 α , 12 α тригидрокси-5 β -холановую кислоту получают в достаточном количестве из желчи крупного рогатого скота, из которой можно получать метилового эфира 3 α , 7 α -диацетокси -12 α -гидрокси-5 β -холановой кислоты, п-толуолсульфохлорид, синтезирующихся при сульфохлорировании толуола, хлорсульфоновой кислоты.

Строение синтезированного 12 α -тозилоксиэфира 3 α , 7 α -диацетокси-метил-5 β -холановой кислоты доказано методом ИК-спектроскопии, и чистота определялась методом аналитической тонкослойной хроматографии.

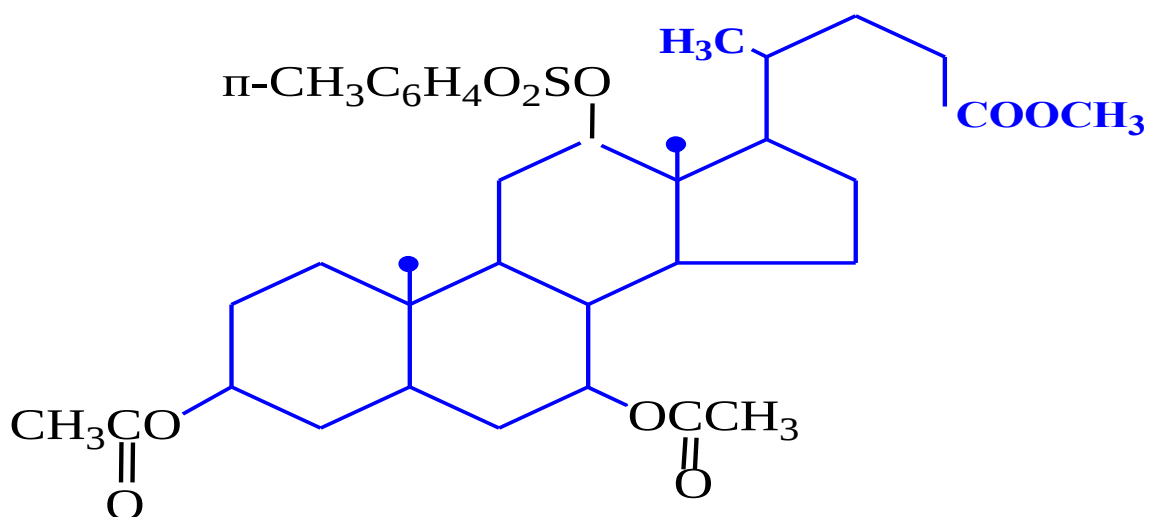
Противомикробную активность соединения определяли in vitro методом серийных разведений по отношению к полевым культурам: стафилококка, нокардии, пастареллы, коринбактерий, выделенных от больных животных респираторными заболеваниями.

Опыт проводили в трёх повторностях.

Подавляющая концентрация 12 α -тозилоксиэфира 3 α , 7 α -диацетокси-метил-5 β -холановой кислоты составляла по отношению к стафилакокку - 35,2-69,3мкг/мл, нокардии - 145-238 коринбактерий-138-159, и пастареллам - 95-110мкг/мл.

Формула изобретения

12 α -тозилоксиэфир -3 α , 7 α -диацетокси метил-5 β –холановой кислоты в качестве противомикробного средства, имеет следующую структурную формулу:



Компьютерный набор: Фатхуллова М.С.

Заказ

Тираж

Подписное

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