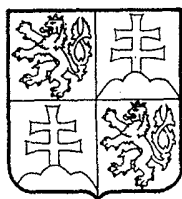


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATÍVNA
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNY ÚRAD
PRE VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVEDČENIU

271 547

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁵

C 07 D 277/74

(21) PV 141-89.P

(22) Prihlásené 09 01 89

(40) Zverejnené 12 02 90

(45) Vydané 19 08 91

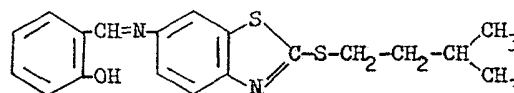
(75) Autor vynálezu

SIDŔOVÁ EVA ing. CSc., BRATISLAVA,
DANĚK JAROSLAV MVDr. CSc., JÍLOVÉ U PRAHY

(54)

2-Izopentyltio-6-salicylidénaminobenzo-
tiazol a spôsob jeho prípravy

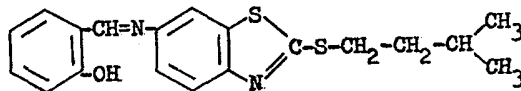
(57) Bol pripravený doteraz neznámy
2-izopentyltio-6-salicylidénaminobenzo-
tiazol. Syntéza uvedenej zlúčeniny sa
uskutočňuje reakciou 6-amino-2-izopentyl-
tiobenzotiazolu so salicylaldehydom v eta-
nole za varu. Zlúčenina je antihelmintic-
ky účinná proti modelovému helmintu Hy-
menolepis nana.



Predmetom vynálezu je 2-izopentyltio-6-salicylidénaminobenzotiazol a spôsob jeho prípravy.

Doteraz známe 2-alkyltio-6-salicylidénaminobenzotiazoly (Sidóová, E. a Foltínová P., Chem. Zvesti 34, 278 /1980/) prejavili fungistatickú účinnosť.

Teraz sme zistili, že doteraz neznáma zlúčenina vzorca



je antihelminticky účinná proti modelovému helmintu *Hymenolepis nana*.

Súčasne bol zistený spôsob prípravy uvedenej zlúčeniny na báze 6-amino-2-izopentyltiobenzotiazolu, ktorý sa vyznačuje tým, že 6-amino-2-izopentyltiobenzotiazol sa nechá reagovať s ekvivalentným množstvom salicylaldehydu v etanole za varu po dobu 1 až 30 minút.

Nasledujúce príklady bližšie osvetľujú, ale nijako neobmedzujú prípravu, a vlastnosti zlúčeniny podľa vynálezu.

Príklad 1

Príprava 2-izopentyltio-6-salicylidénaminobenzotiazolu

Surový 6-amino-2-izopentyltiobenzotiazol (5,05 g, 0,02 mol), získaný podľa Sidóovej E. a Odlerovej Ž. (Čs. AO 189212 /1978/) v podobe oleja sa rozpustil v etanole (30 cm³). K roztoku sa pridal salicylaldehyd (2,45 g, 0,02 mol) a reakčná zmes sa zahriala na 2 minúty do varu. Po pridaní ďalšej dávky etanolu (70 cm³) sa zmes odfarbila aktívnym uhlím. Z filtrátu vypadnutý olejový produkt odstavením pri 5 °C cez noc stuhol na kryštalickú látku o t.t. 63 až 65 °C, ktorá nevyžadovala ďalšie čistenie. Výťažok činil 4,8 g (67,6 %).

Pre C₁₉H₂₀N₂OS₂

vypočítané % : C 64,01 H 5,65 N 7,86 S 17,99

zistené % : 64,15 5,69 7,84 18,04

Príklad 2

Antihelmintická účinnosť zlúčeniny podľa vynálezu proti modelovému helmintu *Hymenolepis nana* var. *fraterna* (Stiles, 1908).

Antihelmintická účinnosť bola stanovená na myšiach-samcoch kmeňa NMRI o živej hmotnosti 12 až 15 g. Počet myši v skupine tvoril vždy 6 kusov. 2 skupiny boli kontrolne invadované, neliečené, jedna skupina liečená štandardným preparátom (piperazínová soľ niklosamidu) a ďalšej skupine bola aplikovaná zlúčenina podľa vynálezu. Invázia sa vykonávala štandardným množstvom zrelých vajíčok *Hymenolepis nana* sondou per os. Zlúčenina podľa vynálezu sa aplikovala na 17. a 18. deň po invázii vajíčok, rozpustená v Dorfmanovom činidle v dávke 150 mg kg⁻¹ živej hmoty. Myšiam v kontrolných neliečených skupinách sa zhodným spôsobom podalo Dorfmanovo činidlo. Po hladovke na 20. deň po invázii vajíčok, bol pokus ukončený na 21. deň zabitím myši a helmintologickou pitvou tenkého čreva. Počítali sa celé pásomnice (*Hymenolepis nana*) s hlavičkou.

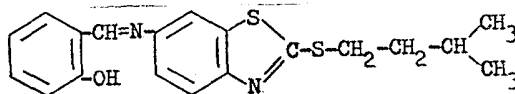
Zlúčenina podľa vynálezu prejavila účinnosť, ktorá zodpovedá 69,5 % účinnosti piperazínovej soli niklosamidu.

Významný je fakt, že doteraz neznáma zlúčenina novej štruktúry prejavila účinnosť proti modelovému helmintu *Hymenolepis nana*, ktorá predstavuje 69,5 % účinnosti zavedeného preparátu.

Zlúčeninu podľa vynálezu možno používať ako účinnú zložku antihelmintických prípravkov alebo ako medziprodukt pre ďalšie syntézy.

P R E D M E T V Y N Á L E Z U

1. 2-Izopentyltio-6-salicylidénaminobenzotiazol vzorca



2. Spôsob prípravy zlúčeniny podľa bodu 1 vyznačený tým, že sa nechá reagovať 6-amino-izopentyltiobenzotiazol s ekvivalentným množstvom salicylaldehydu v etanole za varu po dobu 1 až 30 minút.