



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

242023

(11)

(B1)

[22] Přihlášeno 12 10 84
[21] (PV 7796-84)

[40] Zveřejněno 22 08 85

[45] Vydáno 15 09 87

[51] Int. Cl.⁴
C 07 C 103/76
//A 61 K 31/165

[75]

Autor vynálezu

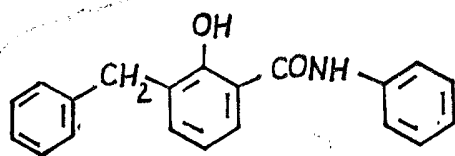
ZIKÁN VIKTOR ing. CSc.; NĚMCOVÁ DAGMAR ing., PRAHA;
DANĚK JAROSLAV MVDr. CSc., JÍLOVÉ u Prahy;
ŠPALDONOVÁ RADMILA RNDr. PhMr. DrSc., KOŠICE

[54] Anilid kyseliny 3-benzylsalicylové

1

2

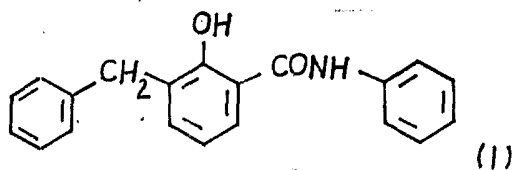
Anilid kyseliny 3-benzylsalicylové vzor-
ce I



Způsob jeho přípravy spočívá v reakci kyseliny 3-benzylsalicylové s anilinem v xylenu za přítomnosti fosfortrichloridu za zvýšené teploty.

Tato nová, dosud nepopsaná látka vykazuje anthelmintickou účinnost proti modelovému helmintu *Aspicularis tetraptera*.

Vynález se týká anilidu kyseliny 3-benzylsalicylové vzorce I



Tato nová, dosud nepopsaná, sloučenina vykazuje použitelnou anthelmintickou účinnost, zejména proti modelovému helmintu *Aspicularis tetraptera*.

Sloučeninu vzorce I lze podle vynálezu připravit reakcí o sobě známé kyseliny 3-benzylsalicylové (US pat. č. 2 042 343) s anilinem v přítomnosti fosfortrichloridu v prostředí inertního rozpouštědla za zvýšené teploty, výhodně s 0,35 molárním množstvím fosfortrichloridu v xylenu při teplotě 130 až 140 °C.

Hodnocení anthelmintické účinnosti proti modelovému helmintu *Aspicularis tetraptera*

Pokusy byly provedeny na myších samcích kmene SPF/Velaz s hmotností 18 až 20 gramů ve skupinách po 3 kusech. Myši by-

ly invadovány způsobem per os dávkou 80 až 100 vajíček/myš modelového helmintu *Aspicularis tetraptera* a po ukončení vývinu parazita do pohlavní zralosti byla aplikována zkoušená látka vzorce I. Látka byla aplikována per os duodenální sondou v Dorfmanově činidle v dávce 150 mg/kg a 75 mg/kg po dobu 3 dní. Po 7 dnech od první aplikace byl makroskopicky u dekapitovaných myší zjišťován počet červů ve střevě v porovnání s kontrolní skupinou neléčených zvířat a výpočtem podle Stewarda stanovena v průměru 93,3 % anthelmintická účinnost hodnocené látky vzorce I.

Způsob přípravy látky vzorce I je jednoduchý, bližší podrobnosti vyplývají z následujícího příkladu provedení. Uvedený příklad vynález pouze ilustruje, nikoli omezuje:

Směs 7,53 g kyseliny 3-benzylsalicylové (33 mmol) a 3,07 g anilinu (33 mmol) a 70 mililitrů xylenu byla zahřáta k varu a k vroucímu roztoku přikapáno 1,58 g fosfortrichloridu (11,5 mmol). Reakční směs byla zahřívána při teplotě 130 až 140 °C po dobu 4 h pod zpětným chladičem a po ochlazení vytřepána 5% vodným roztokem hydrogenuhlíkatu sodného. Organická vrstva byla destilací za tlaku 1,5 kPa zbavena rozpouštědla a odparek překrystalován ze směsi chloroformu s hexanem. Bylo získáno 9,1 g (91%) anilidu kyseliny 3-benzylsalicylové o t. t. 77 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Anlid kyseliny 3-benzylsalicylové vzorce I

