



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

254605

(11)

(B1)

(51) Int. Cl.⁴

C 07 D 241/46

(22) Přihlášeno 08 05 86

(21) PV 3357-86.G

(40) Zveřejněno 14 05 87

(45) Vydáno 15 09 88

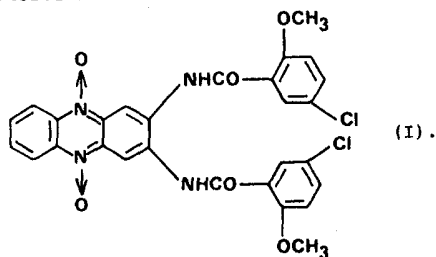
(75)

Autor vynálezu

ZIKÁN VIKTOR ing. CSc., SLUKA JAROSLAV ing., PRAHA,
DANĚK JAROSLAV MVDr. CSc., RADLÍK

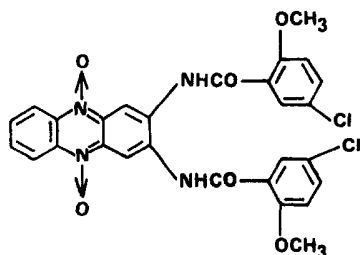
(54) 2,3-bis(2-methoxy-5-chlorbenzamido)fenazin-5,10-dioxid

Řešení se týká 2,3-bis(2-methoxy-
-5-chlorbenzamido)fenazin-5,10-dioxidu
vzorce I



Tato nová látka vykazuje anthelmintickou
účinnost proti modelovému helmintu
Hymenolepis nana a *Nippostrongylus*
brasiliensis.

Vynález se týká 2,3-bis(2-methoxy-5-chlorbenzamido)fenazinu-5,10-dioxidu vzorce I



(I).

Tato nová dosud nepopsaná sloučenina vykazuje použitelnou anthelmintickou účinnost, zejména proti modelovému helmintu *Hymenolepis nana* a *Nippostrongylus brasiliensis*.

Sloučeninu vzorce I lze připravit reakcí 2,3-bis(2-methoxy-5-chlorbenzamido)fenazinu (čs. AO č. 254 604) s 30% roztokem peroxidu vodíku v prostředí ledové kyseliny octové při teplotě 60 °C až 70 °C.

Hodnocení anthelmintické účinnosti proti modelovému helmitu *Hymenolepis nana*.

Testy byly provedeny na myších samcích kmene H s hmotností 10 až 13 g ve skupinách po 6 kusech. Dvě ze tří kontrolních skupin byly invadované neléčené, třetí invadovaná, léčená standardním přípravkem - piperazinovou solí niclosamidu - vůči němuž byla účinnost porovnávána. Invaze byla prováděna sondou perorálně vždy 500 zralými vajíčky *Hymenolepis nana* v objemu 0,25 ml/myš. Sloučenina vzorce I byla aplikována 13. a 14. den po invazi perorálně sondou v dávce 150 mg.kg⁻¹ ž. hm. (živé hmotnosti) jako homogenát v Dorfmanově činidle. Myši byly po aplikaci 3. den zabity a po zjištění celkového počtu tasemnic se skolexy při úplné helmintologické pitvě tenkého střeva myší byla, výpočtem metodou nepřímé aktivity dle Stewarda, stanovena v průměru 60% anthelmintická účinnost hodnocené látky vzorce I.

Hodnocení anthelmintické účinnosti proti modelovému helmintu *Nippostrongylus brasiliensis*.

Testy byly provedeny na krysích samcích kmene Black head s hmotností 120 až 140 g ve skupinách po 6 kusech. Dvě ze tří kontrolních skupin byly invadované neléčené, třetí invadovaná léčená standardním přípravkem levamisolem, vůči němuž byla účinnost porovnávána. Krysy byly invadovány 500 pohyblivými larvami *Nippostrongylus brasiliensis* podkožně do hřbetní krajiny mezi lopatkami. 8. den po invazi byla jednorázově aplikována látka vzorce I v dávce 150 mg.kg⁻¹ ž. hm. Látka byla krysám podána sondou orálně jako homogenát v Dorfmanově činidle a pokus byl ukončen 12. den zabitím zvířat a provedením helmintologické pitvy tenkého střeva. Ze zjištěného celkového počtu červů ve střevě a výpočtem metodou nepřímé aktivity dle Stewarda, byla stanovena v průměru 59,7% anthelmintická účinnost hodnocené látky vzorce I.

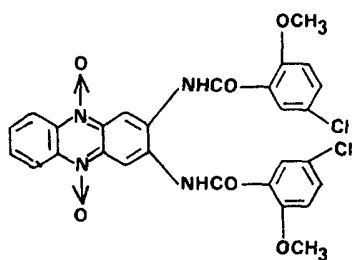
Způsob přípravy látky vzorce I dle vynálezu je jednoduchý, bližší podrobnosti vyplývají z následujícího příkladu provedení. Uvedený příklad vynález pouze ilustruje, nikoliv omezuje.

P ř í k l a d

K suspenzi 5,47 g (0,01 mol) 2,3-bis(2-methoxy-5-chlorbenzamido)fenazinu ve 200 ml ledové kyseliny octové bylo za míchání přikapáno 40 ml 30% peroxidu vodíku a směs dále míchána 15 h při teplotě 60 až 70 °C. Chladná reakční směs byla odsáta a surový produkt překrystalisován z dimethylformamidu. Získáno 3,93 g (67,9 %) látky o t.t. 248 až 249 °C a složení C₂₈H₂₀Cl₂N₄O₆.

P R E D M Ě T V Y N Á L E Z U

2,3-bis(2-methoxy-5-chlorbenzamido) fenazín-5,10-dioxid vzorce I



(I) .