



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

254543

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴

C 07 D 241/46

(22) Přihlášeno 08 05 86

(21) PV 3358-86.I

(40) Zveřejněno 14 05 87

(45) Vydáno 15 09 88

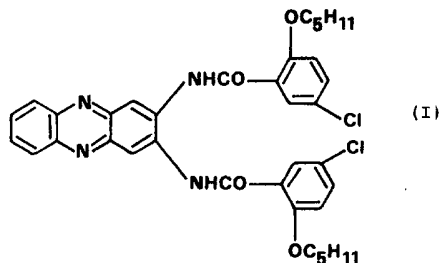
(75)

Autor vynálezu

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

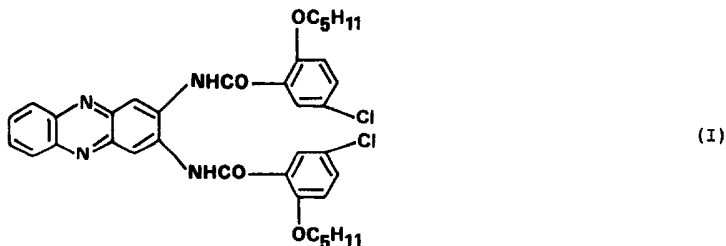
(54) 2,3-Bis(2-pentyloxy-5-chlorbenzamido)-fenazin

Řešení se týká 2,3-bis(2-pentyloxy-5-chlorbenzamido)-fenazinu vzorce I



Tato nová, dosud nepopsaná látka vykazuje anthelmintickou účinnost proti modelovému helmintu *Nippostrongylus brasiliensis*.

Vynález se týká 2,3-bis(2-pentyloxy-5-chlorbenzamido)fenazinu vzorce I



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

Sloučeninu vzorce I lze připravit reakcí 2,3-diaminofenazinu s chloridem kyseliny 2-pentyloxy-5-chlorbenzoové v prostředí pyridinu při teplotě 20 až 30 °C.

Hodnocení anthelmintické účinnosti proti modelovému helmintu *Nippostrongylus brasiliensis*:

Testy byly provedeny na krysích samcích kmene Black head a Wistar 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 látky porovnáována. 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 živé hmotnosti. 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, v porovnání s kontrolní skupinou neléčených zvířat a výpočtem metodou nepřímé aktivity podle Stewarda, byla stanovena v průměru 79% anthelmintická účinnost hodnocené látky vzorce I.

Způsob přípravy látky vzorce I podle 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 10,51 g (0,05 mol) 2,3-diaminofenazinu ve 100 ml pyridinu bylo za míchání při teplotě 20 až 30 °C přikapáno 26,11 g (0,1 mol) 2-pentyloxy-5-chlorbenzoylchloridu a směs míchána 6 h při teplotě 20 °C. Poté byla reakční směs nalita do 800 ml vody, vyloučený produkt odsát a překrystalizován z ethanolu. Získáno 8,47 g (25,7 %) látky o t.t. 159,4 až 160,2 °C a složení C₃₆H₃₆Cl₂N₄O₄.

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

2,3-bis(2-pentyloxy-5-chlorbenzamido)fenazin vzorce I

