

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

257399

(11)

(B1)

[22] Prihlášené 12 02 87
[21] (PV 927-87.N)

[40] Zverejnené 17 09 87

[45] Vydané 15 12 88

[51] Int. Cl.⁴
C 07 D 277/70

[75]

Autor vynálezu

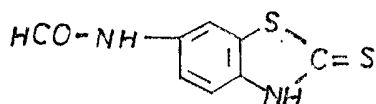
SIDÓOVÁ EVA ing. CSc., ODLEROVÁ ŽELMÍRA MUDr. CSc.,
BRATISLAVA

(54) 6-Formamido-2-benzotiazolínión

1

2

Riešenie sa týka doteraz neznámeho 6-
formamido-2-benzotiazolíniónu vzorca

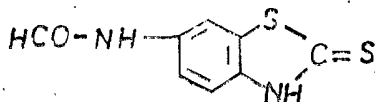


a spôsobu jeho prípravy.

Reakcia sa uskutočňuje formyláciou 6-
amino-2-benzotiazolíniónu 85 %-nou kyse-
linou mravčou pri teplote varu. Nová zlúče-
nina je antimykobakteriálne účinná proti
tuberkulóznym mykobaktériám, najmä pro-
ti atypickým kmeňom *M. avium*, *M. fortui-*
tum a *M. kansasii*; možno ju používať ako
účinnú zložku antimykobakteriálnych prí-
pravkov, alebo ako medziprodukt pre ďalšie
syntézy.

Predmetom vynálezu je 6-formamido-2-benzotiazolíntión. 2-Benzotiazolíntión je antimikrobiálne účinná zlúčenina. Ako fungicíd je účinnou zložkou zavedeného preparátu Dermacid, okrem toho je účinný aj antimykobakteriálne.

Teraz bolo zistené, že do teraz neznáma zlúčenina vzorca



je účinná proti typickým tuberkulóznym mykobaktériám *Mycobacterium (M.) tuberculosis H₃₇R_v*, aj proti atypickým tuberkulóznym mykobaktériám *M. kansasii*, *M. avium* a *M. fortuitum*.

Súčasne bol zistený spôsob prípravy uvedenej zlúčeniny na báze 6-amíno-2-benzotiazolíntiónu. Reakcia sa uskutočňuje acyláciou 6-amíno-2-benzotiazolíntiónu 85 %-nou kyselinou mravčou v molárnom pomere 1 : 4 až 1 : 12 pri teplote 70 až 101 °C po dobu 1 až 30 minút.

Látka	MIC oproti <i>Mycobacterium</i> ($\mu\text{g} \cdot \text{cm}^{-3}$)			
	tbc. <i>H₃₇R_v</i>	kansasii PKG 8	avium 16/18	fortuitum č. 1021
Zlúčenina podľa vynálezu	25	25	25	50
Isoniazid (INH)	1	5	50	25
Etionamid (ETA)	5	25	25	50

MIC = minimálna inhibičná koncentrácia v $\mu\text{g} \cdot \text{cm}^{-3}$

Antimykobakteriálna účinnosť proti tuberkulóznym mykobaktériám bola sledovaná v tekutej šulovej pôde zriedovacím testom. Ako rozpúšťadlo bol použitý dimetylsulfoxid. Výsledná koncentrácia látok v pôde bola 0,5, 1, 5, 10, 25, 50 a 100 $\mu\text{g} \cdot \text{cm}^{-3}$. Významný je fakt, že zlúčenina podľa vynálezu je novej, doteraz neznámej štruktúry a svojou antimykobakteriálnou účinnosťou, najmä proti atypickým tuberkulóznym mykobaktériám je porovnateľná so známymi antituberkulotikami Isoniazid a Etionamid. Zlúčeninu podľa vynálezu možno používať ako účinnú zložku antimykobakteriálnych prípravkov, alebo ako medziprodukt pre ďalšie syntézy.

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

Príklad 1

Príprava 6-formamido-2-benzotiazolíntiónu

6-Amíno-2-benzotiazolýntión (5,45 g, 0,03 mólu) a 85 %-ná kyselina mravčia (7,5 cm³, 9 g, 0,166 mólu) boli spolu zahriate do varu. Po dvoch minútach varu sa zmes odstavila na 30 minút, potom sa vyliala do studenej vody (300 cm³). Získal sa čistý 6-formamido-2-benzotiazolíntión o t. t. 257 až 259,5 °C za rozkladu, ktorý okrem dôkladného premývania vodou do neutrálnej reakcie nevyžadoval ďalšie čistenie. Výťažok činil 5,7 g (89,5 %).

Pre C₈H₆N₂OS₂ (212,29)

vypočítané:

45,26 % C, 3,80 % H, 13,20 % N, 30,21 % S,

zistené:

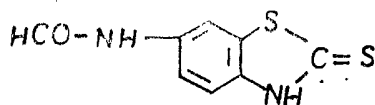
45,56 % C, 3,67 % H, 13,08 % N, 30,32 % S.

Príklad 2

Antimykobakteriálna účinnosť zlúčeniny podľa vynálezu v porovnaní s účinnosťou známych antituberkulotík

PREDMET VYNÁLEZU

1. 6-Formamido-2-benzotiazolíntión vzorca



2. Spôsob prípravy zlúčeniny podľa bodu 1 vyznačený tým, že sa nechá reagovať 6-amíno-2-benzotiazolíntión s 85 %-nou kyselinou mravčou v molárnom pomere 1 : 4 až 1 : 12 pri teplote 70 až 101 °C po dobu 1 až 30 minút.