

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

111269

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 07.12.78 (P. 211571)

Pierwszeństwo: _____

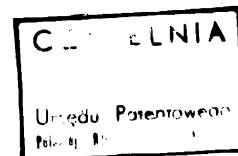
Zgłoszenie ogłoszono: 05.11.79

Opis patentowy opublikowano: 30.09.1981

Int. Cl.².

C07D 401/06

C07D 239/62



Twórcy wynalazku: Bogusław Bobrański, Helena Śladowska, Jolanta Krupińska,
Barbara Cebo

Uprawniony z patentu tymczasowego: Akademia Medyczna,
Wrocław (Polska)

Sposób wytwarzania nowego kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5- -piperydynometylobarbiturowego

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowego kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5-piperydynometylobarbiturowego o wzorze strukturalnym przedstawionym na rysunku. Kwas ten wykazuje działanie przeciwpalne porównywalne bądź silniejsze od fenylobutazonu i jest przeznaczony do stosowania w medycynie i weterynarii.

Według wynalazku sposób wytwarzania kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5-piperydynometylobarbiturowego, o wzorze strukturalnym przedstawionym na rysunku, polega na tym, że kwas 1-cykloheksylo-5-allilobarbiturowy kondensuje się z formaldehydem i piperydyną w roztworze alkoholowym w temperaturze pokojowej, a wydzielone w egzotermicznej reakcji kryształy oczyszcza się przez krystalizację. Korzystne jest stosowanie w przybliżeniu równomolowych ilości reagentów.

Związek wytwarzany sposobem według wynalazku wykazuje w badaniach farmakologicznych działanie przeciwpalne, które oceniano w stosunku do wzorca, którym był fenylobutazon. Podawany w dawce dwukrotnie wyższej niż fenylobutazon wykazuje w teście karageninowym i ksilenowym wyższą aktywność przeciwpalną niż preparat odniesienia. Dobrze wchłania się z przewodu pokarmowego i nie powoduje szkodliwego ubocznego działania na organizm badanych zwierząt.

Podczas badań okazało się, że kondensacja znanego kwasu 1-cykloheksylo-5-allilobarbiturowego, mającego właściwości przeciwpalne, z formaliną i piperydyną, prowadzi do zmian strukturalnych dających w efekcie równą lub wyższą aktywność przeciwpalną i równocześnie znacznie lepszą wchłanianiałość z przewodu pokarmowego badanych zwierząt. Na podstawie istniejących publikacji tego rodzaju skutek nie mógł być z góry przewidywany.

Przedmiot wynalazku jest przedstawiony w przykładzie wykonania.

Do zawiesziny 5 g, to jest 0,02 mola, kwasu 1-cykloheksylo-5-allilobarbiturowego w 24 cm³ etanolu dodaje się 2 cm³ 33% formaliny oraz 1,88 g, to jest 0,022 mola piperydiny. Po egzotermicznej reakcji z klarowanego roztworu wydzielają się kryształy, które po odsączeniu oczyszcza się przez krystalizację z etanolu. Otrzymuje się 4 g kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5-piperydynometylobarbiturowego, co odpowiada 57% wydajności teoretycznej. Otrzymany kwas ma postać bezbarwnych kryształów, które topnieją w temperaturze 108 do 110°C.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania nowego kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5- piperydynometylobarbiturowego o wzorze strukturalnym przedstawionym na rysunku, z n a m i e n n y t y m, że kwas 1-cykloheksylo-5-allilobarbiturowy kondensuje się z formaldehydem i piperydyną w roztworze alkoholowym w temperaturze pokojowej, a wydzielone w egzotermicznej reakcji kryształy oczyszcza się przez krystalizację.

2. Sposób według zastrz. 1, z n a m i e n n y t y m, że stosuje się w przybliżeniu równomolowe ilości reagentów.

