



**URZĄD
PATENTOWY
PRL**

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Int. Cl.³ C07D 513/04
//A61K 31/425
A61K 31/44

Zgłoszono: 83 06 01 (P. 242302)

Pierwszeństwo _____

Zgłoszenie ogłoszono: 84 07 30

Opis patentowy opublikowano: 1986 04 30

CZYTELNIA

Urzędu Patentowego
Polskiej Rzeczypospolitej Ludowej

Twórcy wynalazku: Tadeusz Zawisza, Wiesław Malinka

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

Sposób wytwarzania nowego 2H-4,6-dimetylopirydo- [3,2-d] -izotiazolin-3-onu

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowego 2H-4,6-dimetylopirydo-[3,2-d]-izotiazolin-3-onu o wzorze przedstawionym na rysunku. Związek wytworzony sposobem według wynalazku wykazuje aktywność biologiczną.

Według wynalazku sposób wytwarzania nowego 2H-4,6-dimetylopirydo-[3,2-d]-izotiazolin-3-onu, o wzorze przedstawionym na rysunku, polega na ogrzewaniu nitrylu lub amidu kwasu 4,6-dimetylo-2-merkaptonikotynowego w stężonym kwasie siarkowym w temperaturze 363–373 K w czasie 1–2 godzin.

Podczas badań skringingowych na myszach i szczurach okazało się, że związek wytworzony sposobem według wynalazku wykazuje aktywność biologiczną. Działa on hamująco na agresję zwierząt izolowanych i wykazuje słaby synergizm z heksobarbitem. Podawany zwierzętom doświadczalnym dootrzewnowo w formie 1% zawiesiny w tytozie wykazuje $LD_{50} = 476$ mg/kg.

Przedmiot wynalazku jest przedstawiony w dwóch przykładach wykonania.

Przykład I. 16,4 g (0,1 mola) 3-cyjano-4,6-dimetylo-2-merkaptopyrydiny rozpuszcza się w 70 ml stężonego kwasu siarkowego ($d \sim 1,83$) i przy mieszaniu ogrzewa w 373 K przez 1 godzinę. Po ochłodzeniu roztwór wylewa się na 300 g lodu i neutralizuje 25% roztworem amoniaku, chłodząc przez dodawanie lodu do zobojętnianego roztworu. Osad wydzielający się w trakcie neutralizacji rozpuszcza się przez dodanie nadmiaru amoniaku i uzyskuje końcową objętość roztworu 0,6–0,7 litra. Po przesączeniu filtrat zakwasza się kwasem octowym, a wydzielony osad odsącza się po dwóch godzinach. Uzyskuje się 13,0–14,5 g produktu, o temperaturze topnienia 467–469 K z wydajnością 72–80% wydajności teoretycznej.

Przykład II. Identycznie postępuje się wychodząc z 1,82 g (0,01 mola) amidu kwasu 4,6-dimetylo-2-merkaptonikotynowego i otrzymuje się 1,25 g produktu z wydajnością 70% wydajności teoretycznej.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowego 2H-4,6-dimetylopirydo-[3,2-d]-izotiazolin-3-onu, o wzorze przedstawionym na rysunku, **znamienny tym**, że nityl lub amid kwasu 4,6-dimetylo-2-merkaptonikotynowego ogrzewa się w stężonym kwasie siarkowym w temperaturze 363–373 K. w czasie 1–2 godzin.

