

C07 d 51/20



BIBLIOTEKA

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 39126

Kl. 12 p, 7/01

Akademia Medyczna we Wrocławiu *)
(Zakład Chemii Farmaceutycznej)

Wrocław, Polska

Sposób otrzymywania pochodnych kwasu barbiturowego podstawionych w położeniu 5 rodnikami alifatycznymi zawierającymi grupę hydroksylową i atom jodu

Patent trwa od dnia 23 lipca 1955 r.

Bezpośrednie działanie jodu na pochodne kwasu barbiturowego, zawierające w położeniu 5 rodniki nienasycone, było badane tylko na przykładzie kwasu 5,5-dwualilobarbiturowego. Bougault i Guillaou (Comptes rendus de l'Academ Sc. 193, 493/1931) podają że w wyniku działania jodu w środowisku bardzo słabo zasadowym powstaje związek o składzie $C_{10}H_{10}O_3N_2J_2$.

Stwierdzono, że jeśli jod działa w kwaśnym środowisku wodnym, w temperaturze 70—100° C na pochodne kwasu barbiturowego, zawierające w położeniu 5 rodniki nienasycone, ulega przyłączeniu jedna cząsteczka kwasu podjodowego. Z kwasu 5-izopropiło-5-allilobarbiturowego powstaje kwas 5-izopropiło-5(β hydroksy γ - jodopropiło)-barbiturowy, z kwasu 5,5-dwualilobarbiturowego tworzy się kwas 5-alliło-5- β hydroksy- γ -jodopropiło-barbiturowy. Analogicznie z kwasu 5-fenilo-5-allilobarbiturowego powstaje kwas 5-fenilo-5-(β -hydroksy- γ - jodopropiło)-barbiturowy, zaś z kwasu 5-alliło-5-izopentylobarbiturowego kwas 5-izopentyło-5-

(β -hydroksy- γ -jodopropiło)-barbiturowy. Zamiast jodu można stosować mieszaninę 5 gramocząsteczek jodku i 1 gramocząsteczki jodanu potasowego w obecności nadmiaru kwasu siarkowego.

Otrzymane pochodne kwasu barbiturowego okazują działanie lecznicze w chorobach ośrodkowego układu nerwowego.

Przykład I. 50 g dokładnie sproszkowanego kwasu 5-izopropiło-5-allilobarbiturowego, 6,5 g jodku potasowego, 150 g 2N kwasu siarkowego i 700 ml wody ogrzewa się do temperatury 70—75° C i mieszając, wkrapla powoli roztwór 66 g jodku potasowego i 19 g jodanu potasowego w 400 ml wody. Po zakończeniu reakcji oziębia się produkt reakcji, odsącza, przemywa wodą i oczyszcza przez krystalizację z alkoholu.

*) Właściciel patentu oświadczył, że twórcami wynalazku są prof. dr Bogusław Bobrański, prof. dr Mieczysław Gamski, inż. mgr Tadeusz Jakóbiec i mgr Danuta Prelicz.

Otrzymuje się 63 g kwasu 5-izopropyl-5-(β -hydroksy- γ -jodopropyl)-barbiturowego o temperaturze topnienia 215—217° C z rozkładem. Związek ten jest bardzo trudno rozpuszczalny w wodzie, trudno w alkoholu, łatwo w dioksanie i pirydynie.

Przykład II. 50 g dokładnie sproszkowanego kwasu 5-izopropyl-5-allilobarbiturowego zawieszają w 750 ml wody o temperaturze 70 do 75° C i mieszając wprowadzają powoli 55 g jodu. Po zakończeniu reakcji postępuje się jak podano w przykładzie I, otrzymując 65 g kwasu 5-izopropyl-5-(β -hydroksy- γ -jodopropyl)-barbiturowego.

Przykład III. 10 g dokładnie sproszkowanego kwasu 5,5-dwualilobarbiturowego wprowadza się do 500 ml wody, mieszaninę tę ogrzewa do temperatury 85—90° C i dodaje powoli 11 g sproszkowanego jodu. Po zakończeniu reakcji

odsącza się wydzielony produkt, przemywa go wodą i oczyszcza przez krystalizację z alkoholu. Otrzymuje się 10 g kwasu 5-allil-5-(β -hydroksy- γ -jodopropyl)-barbiturowego o temperaturze topnienia 206—207° C.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób otrzymywania pochodnych kwasu barbiturowego podstawionych w położeniu 5 rodnikami alifatycznymi, zawierającymi grupę hydroksylową i atom jodu, znamienny tym, że na pochodne kwasu barbiturowego, zawierające w położeniu 5 rodniki nienasycone, działa się jodem lub mieszaniną jodku i jodanu potasowego, w kwaśnym środowisku wodnym.

Akademia Medyczna we Wrocławiu
(Zakład Chemii Farmaceutycznej)