



**URZĄD
PATENTOWY
PRL**

**OPIS PATENTOWY
PATENTU TYMCZASOWEGO**

136 595

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

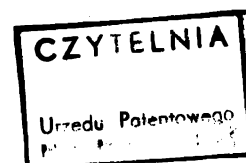
Int. Cl.³ C07D 219/06

Zgłoszono: 84 06 15 (P. 248251)

Pierwszeństwo _____

Zgłoszenie ogłoszono: 85 04 24

Opis patentowy opublikowano: 1987 02 28



Twórcy wynalazku: Zdzisław Szulc, Anna D. Inglot, Jacek Młochowski

Uprawniony z patentu tymczasowego: Politechnika Wrocławska,
Wrocław (Polska)

**Sposób wytwarzania nowego estru etylowego
2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu**

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowego estru etylowego 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu o wzorze 1.

Związek wytworzony sposobem według wynalazku znajduje zastosowanie w syntezie organicznej jako substrat do otrzymywania nowej pochodnej o wzorze 2. Pochodną tą jest sól sodowa 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu. W badaniach wykazuje ona aktywność biologiczną jako efektywny stymulator komórkowego procesu indukcji interferonu.

Według wynalazku, sposób wytwarzania nowego estru etylowego 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu o wzorze 1 polega na tym, że 2,7-dibromoakrydon ogrzewa się do wrzenia z alkoholowym roztworem wodorotlenku potasu, po czym odparowuje rozpuszczalnik, a suchą pozostałość poddaje się reakcji z chlorooctanem etylu ogrzewając reagenty do wrzenia w bezwodnym rozpuszczalniku organicznym, inertnym w stosunku do substratów.

Na podstawie stanu techniki nie można było z góry przewidzieć, że uzyska się reakcję pomiędzy reagentami użytymi w sposobie według wynalazku, prowadzącą do wytworzenia, w dalszej reakcji, nowej soli 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu o wzorze 2 przez ogrzewanie tego estru, uprzednio rozpuszczonego w bezwodnym alkoholu, z wodnym roztworem wodorotlenku sodu.

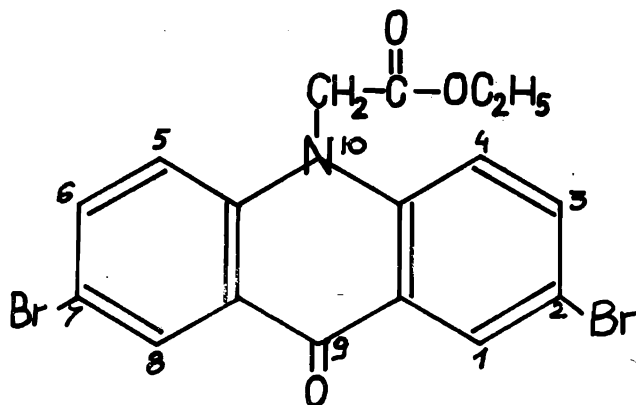
Własności biologiczne soli sodowej 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu o wzorze 2, zostały sprawdzone przez podanie jej dootrzewnowo myszom Balb/c w dawce 50 mg/kg wagi ciała, co spowodowało zwiększenie co najmniej 10-krotne miana interferonu w surowicy mysiej, powstałego w wyniku równoczesnego podania, także dootrzewnowo, znanego syntetycznego induktora interferonu soli sodowej 10-karboksymetyloakrydonu w dawce 200 mg/kg wagi ciała. Przedmiot wynalazku jest przedstawiony w przykładzie wykonania.

Przykład. 2,5 g (0,044 mola) wodorotlenku potasu rozpuszcza się w 50 ml bezwodnego etanolu ogrzewając mieszaninę do wrzenia, po czym dodaje się 7,2 g (0,02 mola) 2,7-dibromoakrydonu i całość ogrzewa się do wrzenia przez 10 minut, a następnie odparowuje rozpuszczalnik organiczny do sucha. Do otrzymanej pozostałości dodaje się 8,8 ml (0,08 mola) chlorooctanu etylu i całość ogrzewa się do wrzenia przez dalszą godzinę w 360 ml bezwodnego

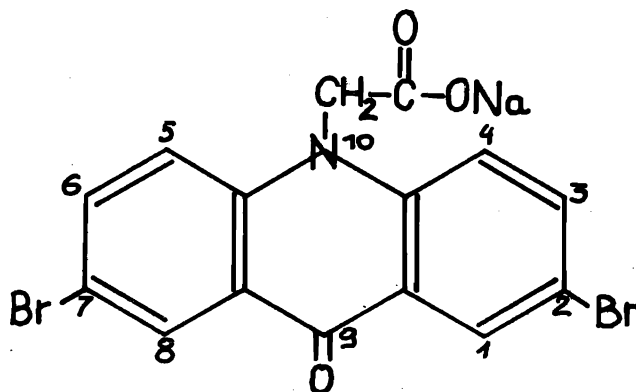
acetonitrylu. Ciepłą jeszcze mieszaninę reakcyjną sączy się, przesącz zagęszcza do 1/3 objętości, następnie ochładza i wydziela krystaliczny żółty osad, który rozpuszcza się w minimalnej ilości ciepłego chloroformu. Roztwór chloroformowy sączy się i odparowuje rozpuszczalnik organiczny do sucha, w wyniku czego otrzymuje się 5,1 g surowego estru etylowego 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu, co stanowi 57% wydajności, w przeliczeniu na użyty do reakcji 2,7-dibromoakrydon. Po oczyszczeniu przez krystalizację z alkoholu metylowego otrzymuje się 4,0 g czystego estru etylowego 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu w postaci jasnożółtych igieł, o temperaturze topnienia 235–238°C.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowego estru etylowego 2,7-dibromo-10-karboksymetylo-akrydonu o wzorze 1, **znamienny tym**, że 2,7-dibromoakrydon ogrzewa się do wrzenia z alkoholowym roztworem wodorotlenku potasowego, po czym odparowuje rozpuszczalnik organiczny do sucha i otrzymuje sól potasową 2,7-dibromoakrydonu, którą następnie poddaje się reakcji z chlorooctanem etylu, ogrzewając reagenty do wrzenia w bezwodnym rozpuszczalniku organicznym, inertym w stosunku do substratów.



wzór 1



wzór 2