

**POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA**



**URZĄD
PATENTOWY
PRL**

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

75 543

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Kl. 12p,7/01

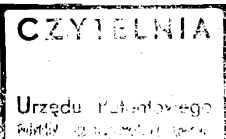
Zgłoszono: 13.05.1972 (P. 155 355)

MKP C07d 51/20

Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 30.05.1973

Opis patentowy opublikowano: 15.01.1975



Twórcy wynalazku: Bogusław Bobrański, Stanisława Ritter, Marian Wilimowski
Uprawniony z patentu tymczasowego: Akademia Medyczna Instytut Chemii i Technologii
Środków Leczniczych, Wrocław (Polska)

Sposób otrzymywania hemiketalu kwasu 5-alkilo-5-(β -hydroksypropylo)-2-dezoksybarbiturowego

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania hemiketalu kwasu 5-alkilo-5-(β -hydroksypropylo)-2-dezoksybarbiturowego mogącego znaleźć zastosowanie jako środek kojący wykazujący działanie uspokajające w przypadku nadmiernego obciążenia ośrodkowego układu nerwowego.

Spośród środków o podobnym działaniu najbardziej zbliżony jest lek, którego sposób otrzymywania objęty jest patentem polskim nr 39125, zgodnie z którym lek jest uzyskiwany na drodze selektywnej hydratacji kwasu 5,5-dwuallilobarbiturowego stężonym kwasem siarkowym.

Lek ten jest przeznaczony przede wszystkim do leczenia bardziej jaskrawych przypadków zakłócenia czynności podwzgórza, jak i do usuwania licznych objawów zaburzeń neurovegetatywnych. Działanie tego leku jest stosunkowo silne, dlatego stosowanie jego nie jest wskazane w przypadku łżejszych objawów wyżej podanych chorób nerwowych.

Celem wynalazku jest uzyskanie takiego związku, który działałby uspokajająco i wykazywał cechy właściwe tzw. mniejszym trankwilizatorom, czyli nadawał się do stosowania szczególnie w łżejszych przypadkach.

Cel ten został osiągnięty przez poddanie kwasu 5,5-dwuallilo-2-dezoksybarbiturowego hydratacji w temperaturze pokojowej za pomocą kwasu siarkowego i wyodrębnieniu produktu reakcji po uprzednim związaniu kwasu siarkowego działaniem węgla baru przez odparowanie przesącza po tych związkach do suchości.

Hydratując porcjalnie kwasy 5-alkilo-5-allilo-2-dezoksybarbiturowe działaniem 96% kwasu siarkowego otrzymuje się hemiketale kwasów 5-alkilo-5- β -hydroksypropylo-2-dezoksybarbiturowego o wzorze ogólnym jak na załączonym rysunku.

Szczególnością tego związku jest to, że działa uspokajająco nie działając jednocześnie nasennie, że jest dobrze rozpuszczalny w wodzie, a tym samym łatwy do podawania. Technologia otrzymywania leku jest stosunkowo nieskomplikowana, a otrzymany środek jest znacznie mniej toksyczny w porównaniu z innymi znanymi lekami o podobnym przeznaczeniu.

P r z y k ł a d. 1,5 g doskonale sproszkowanego kwasu 5,5-dwuallilo-2-dezoksybarbiturowego rozpuszczono w 2,7 cm³ stężonego kwasu siarkowego, ciągle mieszając w temperaturze pokojowej. Po 3 godz. roztwór wlewo

na 20 g lodu. Po dalszych 30 minutach roztwór wodny zneutralizowano 10 g węglanu baru, a następnie odsączono nadmiar węglanu oraz siarczan baru. Przesącz podgęszczono pod zmniejszonym ciśnieniem do sucha. Do pozostałości dodano 5 ml acetonu i odsączono krystaliczny produkt (0,7 g 41,2% wydajności teoretycznej). Produkt ten przekrystalizowany z mieszaniny etanolu i benzenu (1 : 1) dał 0,4 g (25% wydajności teoretycznej produktu o temperaturze topnienia 205°C o budowie i składzie odpowiadającym wzorowi jak na rysunku.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób otrzymywania hemiketalu kwasu 5-alkilo-5-(β-hydroksypropylo)-2-dezoksybarbiturowego, **znamienny** tym, że kwas 5,5-dwualilo-2-dezoksybarbiturowy poddaje się hydratacji w temperaturze pokojowej za pomocą kwasu siarkowego, a produkt reakcji wyodrębnienia się po uprzednim związaniu kwasu siarkowego działaniem węglanu baru przez odparowanie przesącza po tych związkach do suchości.

