

**POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA**



**URZĄD
PATENTOWY
PRL**

O P I S P A T E N T O W Y P A T E N T U T Y M C Z A S O W E G O

75 070

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 09.11.1971 (P. 151 439)

Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 30.05.1973

Opis patentowy opublikowano: 10.02.1975

Kl. 12o,17/04

MKP C07c 133/10

CZYTELNIA

Urzędu Patentowego
Polskiej Rzeczypospolitej Ludowej

Twórcy wynalazku: Mieczysław Konieczny, Jerzy Giełdanowski, Dorota Bierowska,
Julita Teodorczyk

Uprawniony z patentu tymczasowego: Polska Akademia Nauk Instytut Immunologii i Terapii
Doświadczalnej im. Ludwika Hirszfelda, Wrocław (Polska)

Sposób wytwarzania N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidyny

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidyny o wzorze 1, mającej zwłaszcza w postaci soli, np. chlorowodorku, własności antagonistyczne w stosunku do mediatorów stanów zapalnych, takich jak histamina, serotonina, bradykinina itp.

Związki tego rodzaju znajdują zastosowanie w terapii stanów zapalnych o etiologii immunologicznie swoistej i nieswoistej.

N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidyna jest związkiem nowym, nieopisanym dotychczas w literaturze.

Stwierdzono, że N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidynę otrzymuje się na drodze reakcji kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5-acetonylo-barbiturowego o wzorze 2 z aminoguanidyną w postaci soli o wzorze 3, w którym X oznacza dowolną resztę kwasową, w roztworze alkoholowym.

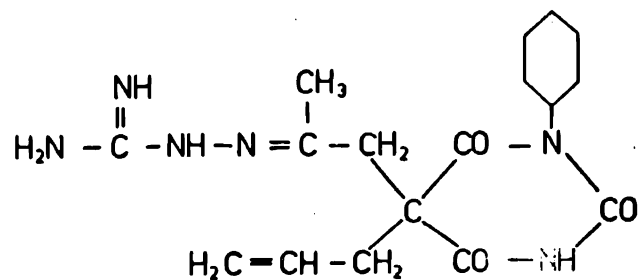
W sposobie według wynalazku mieszaninę reakcyjną ogrzewa się do wrzenia w ciągu 8–12 godzin a produkt końcowy, po oddestylowaniu pod zmniejszonym ciśnieniem, przekształca się z rozpuszczalnika organicznego, np. z acetonitrylu.

Przedmiot wynalazku jest bliżej objaśniony na przykładzie wykonania.

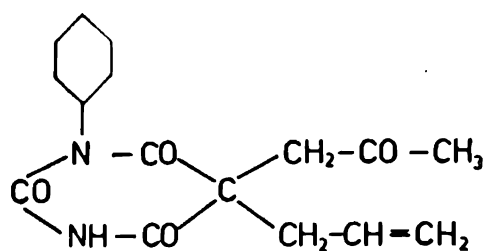
Przykład. 0,72 g węglanu aminoguanidyny, 1,3 ml etanolu, 0,96 ml 5,72 N kwasu solnego i 1,65 g kwasu 1-cykloheksylo-5-allilo-5-acetonylo-barbiturowego ogrzewa się do wrzenia w ciągu 9 godzin. Po oddestylowaniu pod zmniejszonym ciśnieniem do sucha surowy produkt przekształca się z acetonitrylu. Otrzymuje się 1,43 g N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidyny o temperaturze topnienia 167°C, co stanowi 71% wydajności teoretycznej.

Zastrzeżenie patentowe

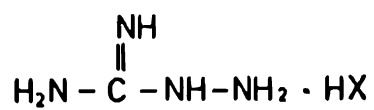
Sposób wytwarzania N-(1-cykloheksylo-5-allilo-5-propylideno-barbiturylo)-aminoguanidyny o wzorze 1, znamienny tym, że kwas 1-cykloheksylo-5-allilo-5-acetonylo-barbiturowy o wzorze 2 poddaje się reakcji z aminoguanidyną w postaci soli o wzorze 3, w którym X oznacza dowolną resztę kwasową, w roztworze alkoholowym.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3