



Patent dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 27.01.76 (P. 186871)

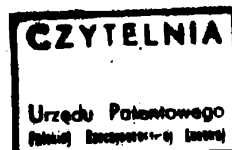
Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 14.08.78

Opis patentowy opublikowano: 30.06.1980

Int. Cl.²

C07D 243/08



Twórcy wynalazku: Bogusław Bobrański, Grażyna Burak

Uprawniony z patentu: Akademia Medyczna, Wrocław (Polska)

Sposób wytwarzania [1,4]-dwubenzyl-6,6-dwuetylo- heksahydro-7H[1,4]-diazepino-5,7-dionu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania [1,4]-dwubenzyl-6,6-dwuetylo-heksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu o wzorze przedstawionym na rysunku.

Wymieniony związek jest związkiem nowym, charakteryzującym się działaniem przeciwbólowym i stanowi materiał wyjściowy do otrzymywania jego pochodnych np. 6,6-dwuetylo-heksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu, wykazujących w badaniach farmakologicznych również działanie kojące.

Według wynalazku sposób wytwarzania [1,4]-dwubenzyl-6,6-dwuetylo-heksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu o wzorze przedstawionym na rysunku, polega na tym, że N,N-dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu kondensuje się z chlorkiem dwuetylomalonowym.

Związek otrzymywany sposobem według wynalazku oraz wspomniana pochodna, badane pod kątem oceny wpływu na ośrodkowy układ nerwowy, wykazują działanie sedatywne, mierzone zmniejszeniem ruchliwości spontanicznej zwierząt doświadczalnych. W dawce 23 mg/kg związek podstawowy zmniejszał ruchliwość spontaniczną o 60%, a w dawce 46 mg/kg o 70%, natomiast pochodna działała słabiej sedatywnie, powodując zmniejszenie ruchliwości spontanicznej o 53%, w dawce 200 mg/kg, a o 42% w dawce 400 mg/kg, wykazując jednak dodatkowe działanie przeciwbólowe. Badane związki zwiększają czas wystąpienia reak-

2

cji bólowej o 63%, sprawdzanej w tzw. teście gorącej płytki.

Przedmiot wynalazku jest przedstawiony w przykładzie wykonania.

0,02 gmola N,N-dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu rozpuszcza się w 45 cm³ suchego benzenu i dodaje wolno 0,01 gmola chlorku dwuetylomalonowego, mieszaninę reakcyjną ogrzewa się do wrzenia przez pięć godzin, jednocześnie mieszając. Następnie odsąca się wydzielony dwuchlorowodorek dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu i po przesączeniu odparowuje się w próżni. Pozostałość przemywa się dodając, a otrzymane bezbarwne kryształy oczyszcza się przez krystalizację z ligrinu.

Wytworzone kryształy o temperaturze topnienia 80–81°C są normalnie rozpuszczalne w etanolu. Uzyskuje się [1,4]-dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu z wydajnością 16,6% w stosunku do przereagowanego chlorku dwuetylomalonowego.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania [1,4]-dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu, o wzorze przedstawionym na rysunku, **znamienny tym**, że N,N-dwubenzyl-6,6-dwuetyloheksahydro-7H [1,4]-diazepino-5,7-dionu kondensuje się z chlorkiem dwuetylomalonowym.

