

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

75 071

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 15.11.1971 (P. 151 565)

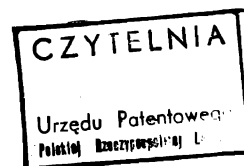
Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 30.05.1973

Opis patentowy opublikowano: 23.12.1974

Kl. 12o,17/04

MKP C07c 129/12



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 otrzymywania N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidyny

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidyny.

N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroguanidyna o wzorze 1 posiada właściwości immunodepresyjne i przeciwzapalne. Związki tego rodzaju stosowane są w terapii przewlekłych stanów zapalnych, np. w przypadku choroby gośćcowej a ponadto tłumiąc syntezę przeciwciał zapobiegają uszkodzeniom narządów wewnętrznych w przebiegu schorzeń immunologicznych.

N-2-(metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidyna jest związkiem nowym, o konkretnie określonych właściwościach farmakologicznych, a sposoby jej otrzymywania nie były dotychczas nigdzie opisane.

Stwierdzono, że N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidynę o wzorze 1 otrzymuje się jeżeli 2-metylocykloheksanon o wzorze 2 poddaje się reakcji w słabo kwaśnym roztworze wodno-alkoholowym z nitroaminoguanidyną o wzorze 3.

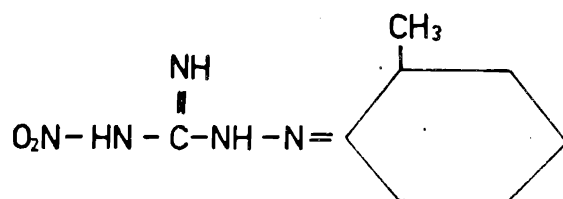
Według wynalazku reakcję prowadzi się korzystnie wobec słabo zdysocjowanego kwasu, np. kwasu octowego ogrzewając mieszaninę reakcyjną do wrzenia w ciągu 10–30 minut.

Przedmiot wynalazku jest bliżej objaśniony na przykładzie wykonania, który jednakże nie ogranicza zakresu wynalazku.

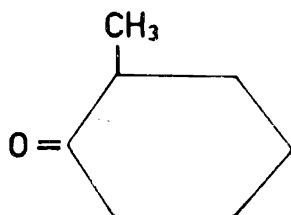
Przykład. 0,6 g nitroaminoguanidyny, 10 ml etanolu, 20 ml wody, 2 ml lodowatego kwasu octowego i 0,6 ml (0,56 g) 2-metylocykloheksanonu ogrzewa się do wrzenia w ciągu 15 minut. Po oziębieniu odsąca się wydzielone kryształy i przekrystalizowuje się z metanolu. Otrzymuje się 0,7 g N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidyny o temperaturze topnienia 133°C, co stanowi 65% wydajności teoretycznej.

Zastrzeżenie patentowe

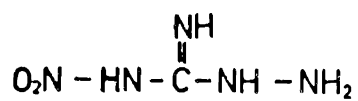
Sposób wytwarzania N-(2-metylocykloheksylideno)-nitroaminoguanidyny o wzorze 1, znamienny tym, że 2-metylocykloheksanon o wzorze 2 poddaje się reakcji w słabo kwaśnym roztworze wodno-alkoholowym z nitroaminoguanidyną o wzorze 3.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3