



Patent tymczasowy dodatkowy  
do patentu nr \_\_\_\_\_

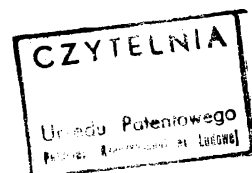
Int. Cl.<sup>3</sup> C07D 239/42

Zgłoszono: 82 10 11 (P. 238608)

Pierwszeństwo \_\_\_\_\_

Zgłoszenie ogłoszono: 83 08 15

Opis patentowy opublikowano: 1986 05 30



**Twórcy wynalazku:** Zdzisław Machoń, Jerzy Cieplik, Marian Mulczyk

**Uprawniony z patentu tymczasowego:** Akademia Medyczna,  
Wrocław (Polska)

### **Sposób wytwarzania nowych aminokwasów pochodnych pierścienia pirymidynowego**

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych aminokwasów pochodnych pierścienia pirymidynowego, o wzorze ogólnym przedstawionym na rysunku, w którym R oznacza rodnik p-chlorofenyłowy lub 3,4-dichlorofenyłowy.

Aminokwasy wytworzone sposobem według wynalazku wykazują silne działanie bakteriostatyczne w stosunku do bakterii Gram dodatnich.

Według wynalazku sposób wytwarzania nowych aminokwasów pochodnych pierścienia pirymidynowego, o wzorze ogólnym przedstawionym na rysunku, w którym R oznacza rodnik p-chlorofenyłowy lub 3,4-dichlorofenyłowy, polega na tym, że kwas 2-fenylo-4-tio-6-metylopirymidyno-5-karboksylowy stapia się z p-chloroaniliną lub 3,4-dichloroaniliną, w temperaturze 180-200°C.

Nieoczekiwanie okazało się, że przeprowadzenie kwasu 2-fenylo-4-tio-6-metylopirymidyno-5-karboksylowego w odpowiednie aminokwasy prowadzi do wytworzenia związków o silnym działaniu przeciwbakteryjnym, czego nie można było z góry przewidzieć. Działanie to zostało potwierdzone w testach przeciwbakteryjnych, które wykazały, że związki te hamują wzrost bakterii Gram dodatnich takich jak *Staphylococcus pyogenes* oraz *Staphylococcus epidermidis* w stężeniach 50-12,5 µg/ml pożywki.

Przedmiot wynalazku jest przedstawiony w dwóch przykładach wykonania.

**Przykład I.** 5 g kwasu 2-fenylo-4-tio-6-metylopirymidyno-5-karboksylowego stapia się z 4 g p-chloroaniliny w temperaturze 190°C przez czas 6 godzin. Następnie całość krystalizuje się z metanolu, otrzymując 4 g kwasu 2-fenylo-4-p-chlorofenyloamino-6-metylopirymidyno-5-karboksylowego, z wydajnością równą 58,9% wydajności teoretycznej. Otrzymany związek ma postać drobnokrystalicznego osadu białego o temperaturze topnienia 213-215°C.

**Przykład II.** 5 g kwasu 2-fenylo-4-tio-6-metylopirymidyno-5-karboksylowego stapia się z 4 g 3,4-dichloroaniliny w temperaturze 190°C przez czas 4 godzin. Następnie całość krystalizuje się z mieszaniny chloroformu i pirydyny, otrzymując 4,4 g kwasu 2-fenylo-4-/3,4-dichlorofenyloamino/-6-metylopirymidyno-5-karboksylowego, z wydajnością równą 59,0% wydajności teoretycznej. Otrzymany związek ma postać białych kryształków o temperaturze topnienia 180-181°C.

## Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowych aminokwasów pochodnych pierścienia pirymidynowego o wzorze ogólnym przedstawionym na rysunku, w którym R oznacza rodnik p-chlorofenyłowy lub 3,4-dichlorofenyłowy, **znamienny tym**, że kwas 2-fenyl-4-tio-6-metylopirymidyno-5-karboksylowy stapia się z p-chloroaniliną lub 3,4-dichloroaniliną, w temperaturze 180–200°C.

