

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

93 084

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 01.06.73 (P. 163062)

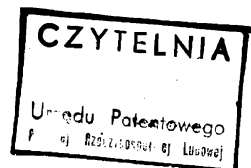
Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 01.02.75

Opis patentowy opublikowano: 15.12.1977

MKP C07d 57/38

Int. Cl.² C07D 473/00



Twórcy wynalazku: Stanisław Kośmider, Andrzej Maślankiewicz, Barbara Rohloff

Uprawniony z patentu tymczasowego: Śląska Akademia Medyczna im. Ludwika Waryńskiego,
Katowice (Polska)

Sposób otrzymywania soli kwasu teofilino-7-octowego i ksylokainy

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania soli kwasu teofilino-7-octowego i ksylokainy.

Znany sposób otrzymywania soli kwasu teofilino-7-octowego i amidu prokainy umożliwia otrzymanie związku dobrze rozpuszczającego się w wodzie, który nie wywołuje skutków ujemnych na przewodnictwo i siłę skurczu mięśnia serca i dlatego może być bezpiecznie stosowany w przypadkach leczenia zaburzeń rytmu serca.

Znany sposób, w którym kwas teofilino-7-octowy miesza się w stosunku 1:1 do 1:1,5 z chlorowodorkiem amidu prokainy w roztworze etanolu i gorącą mieszaninę zobojętnia się etanolem roztworem wodorotlenku sodu, gotuje od 10 do 20 minut i przesącza na gorąco, a po zagęszczeniu osad krystalizuje z etanolu — pozwala na otrzymanie soli kwasu teofilino-7-octowego i amidu prokainy, która dobrze rozpuszcza się w wodzie, a czynne komponenty teofiliny kompensują uboczne skutki działania preparatów antyarytmicznych.

Okazało się, że można również według sposobu otrzymać sól kwasu teofilino-7-octowego z antyarytmikiem w postaci ksylokainy, przy czym kwas teofilino-7-octowy miesza się w stosunku od 1:1 do 1:1,5 z ksylokainą w roztworze etanolu i gorącą mieszaninę zobojętnia etanolem roztworem wodorotlenku sodu i ogrzewa od 10 do 20 minut i przesącza na gorąco, a po zagęszczeniu osad krystalizuje z etanolu uzyskując produkt o temperaturze topnienia = 170–171° z wydajnością 67–70%.

Działając kwasem teofilino-7-octowym $C_9H_{10}N_4O_4$ według opisanego sposobu na ksylokainę $C_{14}H_{23}N_2O \cdot HCl$ w roztworze etanolu uzyskano nowy związek chemiczny sól kwasu teofilino-7-octowego i ksylokainy.

Opisany według wynalazku sposób pozwala na otrzymanie teofilino-7-octanu ksylokainy $(C_9H_{10}N_4O_4)^{(-)} \cdot (C_{14}H_{23}N_2O)^{(+)}$ bezpośrednio z technologicznie dostępnej soli kwasu mineralnego z ksylokainą, przy czym zobojętnienie i usunięcie kwasowego komponenta mineralnego może być przeprowadzone przy użyciu wodorotlenku sodu prowadząc cały proces w roztworze etanolu.

Otrzymana sól kwasu teofilino-7-octowego i amidu prokainy jest dobrze rozpuszczalna w wodzie i znajduje zastosowanie w przypadkach leczenia zaburzeń rytmu serca.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób otrzymywania soli kwasu teofilino-7-octowego i ksyllokainy, z n a m i e n n y t y m , że kwas teofilino-7-octowy miesza się w stosunku od 1:1 do 1:1,5 z ksyllokainą w roztworze etanolu i gorącą mieszaninę zobojętnia etanolowym roztworem wodorotlenku sodu, ogrzewa się od 10 do 20 minut i przesącza na gorąco, a po zagęszczeniu osad krystalizuje z etanolu.