



Patent dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 18.02.74 (P. 192723)

Pierwszeństwo _____

Zgłoszenie ogłoszono: 01.10.75

Opis patentowy opublikowano: 12.10.1979

Int. Cl.²
C07D 307/88

Twórcy wynalazku: Bogusław Borkowski, Witold Wieniawski, Zofia Kołodyńska, Anna Naciążek-Wieniawska, Maria Szczęśniak

Uprawniony z patentu: Instytut Leków, Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania nowego 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalidu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalidu o wzorze przedstawionym na rysunku. Według wynalazku 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalid otrzymuje się przez ogrzewanie kwasu o-acylosyryngowego, korzystnie kwasu o-acetylosyryngowego, z wodnym roztworem formaldehydu w obecności silnego kwasu mineralnego, korzystnie kwasu solnego.

Dotychczas nieznaną 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalid posiada właściwości farmakodynamiczne, które umożliwiają jego zastosowanie jako środka farmaceutycznego działającego żółciopędnie. Działanie to potwierdzono badaniem farmakologicznym na objętość wydzielonej żółci u szczurów.

Porównano działanie 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalidu z działaniem i toksycznością innych środków wpływających na wydzielanie żółci, dla przykładu z kwasem dehydrocholowym i stwierdzono, że 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalid jest związkiem o podobnej toksyczności, wykazującym pięciokrotnie silniejsze działanie.

Badania przeprowadzono na szczurach białych szczepu Wistar. Kontrolowano wpływ preparatu podanego dodwunastniczo na objętość i suchą

2

pozostałość żółci w układzie doświadczalnym, opisanym przez Kalow'a.

Podany przykład wyjaśnia sposób według wynalazku.

5 Przykład. Mieszaninę 72 części kwasu o-acetylosyryngowego, 198 części formaliny 30% i 54 części stężonego kwasu solnego ogrzewa się do wrzenia przez 30 minut, ochładza, a następnie otrzymany osad odsąca się i oczyszcza przez rekrystalizację z bezwodnego alkoholu etylowego, uzyskując produkt o temperaturze topnienia 141—142°C.

15

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania nowego 5-hydroksy-4,6-dwumetoksyftalidu, **znamienny tym**, że kwas o-acylosyryngowy, korzystnie o-acetylosyryngowy, ogrzewa się z wodnym roztworem formaldehydu w obecności kwasu mineralnego.

2. Sposób według zastrzeżenia 1, **znamienny tym**, że reakcję prowadzi się w obecności kwasu solnego.

