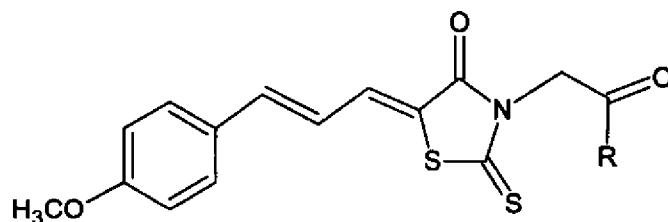


Zastrzeżenia patentowe

1. Kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)rodanino-3-octowy (wzór I, R = OH) oraz jego pochodne będące jego solami lub posiadające zablokowaną grupę karboksylową, które w wyniku reakcji chemicznej prowadzą do powstania kwasu 5-(4'-metoksycynamylideno)rodanino-3-octowego.



Wzór I

2. Związek według zastrzeżenia 1,
gdzie R jest:

-OH,

-OX, gdzie fragment -OX ma budowę jonową $-O^-X^+$ a X^+ jest kationem: K^+ , Na^+ , $^+NA_4$, Ca^{2+} , Mg^{2+} , Al^{3+} lub kationem utworzonym z zasady organicznej, w szczególności takiej jak morfolina, imidazol, izopropylamina, guanidyna, cykloheksylamina,

gdzie każda z czterech grup A niezależnie może być: H, grupą alkilową

zawierającą od 1 do 20 atomów węgla, układem alkil-aryl

zawierającym od 6 do 20 atomów węgla, układem alkil-heteroaryl

zawierającym od 4 do 20 atomów węgla, grupą aryłową opcjonalnie

podstawioną, w szczególności $^+NA_4$ może być $^+NH_4$, $^+NH_3CH_3$,

$^+NH_2(CH_3)_2$, $^+NH(CH_3)_3$, $^+NH_3C_2H_5$, $^+NH_2(C_2H_5)_2$, $^+NH(C_2H_5)_3$,

$^+NH_3C_2H_4OH$, $^+NH_2(C_2H_4OH)_2$, $^+N(CH_3)_3C_2H_4OH$ (cholina),

$^+NH(C_2H_4OH)_3$;

gdzie w przypadku kationów dwudodatnich jedna lub dwie cząsteczki reszt kwasowych przypadają na jeden kation metalu;

gdzie w przypadku kationów trójdatnych jedna, dwie lub trzy cząsteczki reszt kwasowych przypadają na jeden kation metalu;

-OR', gdzie R' jest to grupa alkilowa mająca od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 6 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla, a

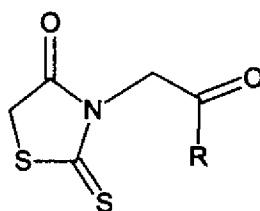
szczególnie preferowanymi grupami alkilowymi są: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl, heksyl, n-heksyl, izoheksyl, oktyl, oleyl, stearyl, $-C_2H_4OH$;

- O-(alkilen)-aryl, gdzie fragment "alkilen" zawiera od 1 do 3 atomów węgla, preferencyjnie: $-CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH(CH_3)-$; oraz preferowaną grupą arylową jest grupa fenylova, opcjonalnie zawierająca podstawniki wybrane z grupy zawierającej: $-OH$, $-OCH_3$, $-OC_2H_5$, $-CH_3$, $-C_2H_5$, $-Cl$, $-Br$, $-NH_2$, $-NHCH_3$, $-NHC_2H_5$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $-COOH$, $-COOCH_3$, $-COOC_2H_5$;
- $-NR''_2$, gdzie każde R'' niezależnie jest: atomem wodoru lub grupą alkilową mającą od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 8 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla; grupa alkilowa może opcjonalnie zawierać podstawniki; preferowanymi grupami alkilowymi R'' są: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl; a w szczególności ugrupowania $-NR''_2$ mają następującą budowę: $-NH_2$, $-NHCH_3$, $-NHC_2H_5$, $-N(CH_3)_2$, $-N(C_2H_5)_2$, $NHCH(CH_3)_2$, $N(CH(CH_3)_2)_2$, NHC_2H_4OH , $-N(C_2H_4OH)_2$;
- $-S-R'''$, gdzie R''' jest grupą alkilową mającą od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 6 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla; na przykład: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl, heksyl; lub
- grupą alkoksylową powstałą po odłączeniu atomu wodoru od grupy hydroksylowej alkoholu wielowodorotlenowego wybranego z grupy zawierającej: glikol etylenowy, glicerynę, poliglicerynę, glikol polietylenowy (PEG) lub glikol polipropylenowy.

3. Związek według zastrzeżenia 2, gdzie R jest $-OH$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-O-t-butyl$, $-S-t-butyl$, $-OK$, $-ONa$, $-ONH_4$, $-NH_2$ lub $-N(C_2H_4OH)_2$.

4. Związek według zastrzeżenia 3, gdzie R jest $-OH$, czyli kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowy.

5. Metoda otrzymywania związku o ogólnym wzorze I według zastrzeżeń 1 do 4 polegająca na reakcji aldehydu 4'-metoksycynamonowego ze związkiem o ogólnym wzorze:



Wzór II

gdzie R jest:

- OH,
- OR', gdzie R' jest to grupa alkilowa mająca od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 6 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla; a szczególnie preferowanymi grupami alkilowymi są: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl, heksyl, n-heksyl, izoheksyl, oktyl, oleyl, stearyl, -C₂H₄OH;
- O-(alkilen)-aryl, gdzie fragment "alkilen" zawiera od 1 do 3 atomów węgla, preferencyjnie: -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH(CH₃)-; oraz preferowaną grupą aryłową jest grupą fenyłową, opcjonalnie zawierającą podstawniki wybrane z grupy zawierającej: -OH, -OCH₃, -OC₂H₅, -CH₃, -C₂H₅, -Cl, -Br, -NH₂, -NHCH₃, -NHC₂H₅, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -COOH, -COOCH₃, -COOC₂H₅;
- NR''₂, gdzie każde R'' niezależnie jest: atomem wodoru, grupą alkilową mającą od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 8 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla; grupa alkilowa może opcjonalnie zawierać podstawniki; preferowanymi grupami alkilowymi R'' są: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl; a w szczególności ugrupowania -NR''₂ mają następującą budowę: : -NH₂, -NHCH₃, -NHC₂H₅, -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, NHCH(CH₃)₂, N(CH(CH₃)₂)₂, -NHC₂H₄OH, -N(C₂H₄OH)₂;
- S-R''', gdzie R''' jest grupą alkilową, mającą od 1 do 20 atomów węgla, preferencyjnie od 1 do 6 atomów węgla, a w szczególności od 2 do 4 atomów węgla; na przykład: metyl, etyl, n-propyl, izopropyl, n-butyl, t-butyl, izobutyl, heksyl; lub
- grupą alkoksyłową powstałą po odłączeniu atomu wodoru od grupy hydroksylowej alkoholu wielowodorotlenowego wybranego z grupy zawierającej: glikol etylenowy, glicerynę, poliglicerynę, glikol polietylenowy (PEG) lub glikol polipropylenowy;

w obecności zasady, w szczególności zasady organicznej, najbardziej preferowaną zasadą organiczną jest trietyloamina;

w alkoholu alifatycznym posiadającym od 1 do 6 atomów węgla, szczególnie w alkoholu posiadającym 3 do 4 atomów węgla, najbardziej preferowanym alkoholem jest izopropanol.

6. Metoda według zastrzeżenia 5, gdzie reakcję prowadzi się w stosunku molowym substratów związku o wzorze II do aldehydem 4'-metoksycynamonowym od 1:1 do 1:1,5, w szczególności 1:1,05 do 1:1,2, szczególnie preferowany stosunek substratów to 1:1,1.

7. Metoda według zastrzeżeń 5 i 6, gdzie związkiem według ogólnego wzoru II jest związek, gdzie R jest -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -O-t-butyl, -S-t-butyl, -NH₂, -N(C₂H₄OH)₂; a w szczególności gdzie R jest -OH, czyli kwas rodanino-3-octowy.

8. Metoda według zastrzeżeń od 5 do 7, która zawiera krok oczyszczania związków według zastrzeżeń 1 do 4 polegająca na krystalizacji produktu reakcji kondensacji według zastrzeżeń 5 do 7 z rozpuszczalnika będącego alkoholem alifatycznym lub kwasem karboksylowym lub ich mieszaniny, w szczególności z alkoholu lub kwasu posiadającym od 1 do 6 atomów węgla, szczególnie w alkoholu posiadającym od 2 do 4 atomów węgla lub kwasu posiadającym od 2 do 3 atomów węgla, najbardziej preferowanym alkoholem jest alkohol izopropylowy, a kwasem karboksylowym jest kwas octowy, najbardziej preferowaną mieszaniną jest mieszana alkoholu izopropylowego i kwasu octowego.

9. Kompozycja farmaceutyczna lub kompozycja do ochrony roślin, zawierająca substancję czynną w połączeniu z co najmniej jednym nośnikiem lub rozpuszczalnikiem farmaceutycznym, która charakteryzuje się tym, że zawiera jako substancję aktywną co najmniej jeden związek o ogólnym wzorze I według zastrzeżeń od 1 do 4.

10. Kompozycja farmaceutyczna lub kompozycja do ochrony roślin, według zastrzeżenia 9, zawierająca (kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowy) lub jego pochodną o ogólnym wzorze I, która w wyniku reakcji hydrolizy, enzymatycznej lub katalitycznej, powoduje powstanie kwasu 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowego.

11. Kompozycja farmaceutyczna według zastrzeżenia 10 zawierająca kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowy.

12. Zastosowanie związków o ogólnym wzorze I według zastrzeżeń od 1 do 4 w leczeniu przeciw pasożytniczym i ochronie przeciw pasożytom, a w szczególności do zwalczania robaków pasożytniczych; zwłaszcza nicieni zarówno u ludzi, zwierząt, jak i roślin.

13. Zastosowanie związków według zastrzeżenia 12 do zwalczania nicieni i ochrony przeciw nicieniom zarówno u ludzi, zwierząt, jak i roślin.

14. Zastosowanie związków według zastrzeżeń 12 i 13, gdzie związek: kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowy) lub jego pochodna o wzorze ogólnym I, która w wyniku reakcji hydrolizy, enzymatycznej lub katalitycznej, powoduje powstanie kwasu 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowego) jest zastosowana jako substancja aktywna do zwalczania pasożytów, zwłaszcza nicieni, zarówno u ludzi, zwierząt, jak i roślin.

15. Zastosowanie związków według zastrzeżeń od 12 do 14, gdzie kwas 5-(4'-metoksycynamylideno)-rodanino-3-octowy jest stosowany w leczeniu przeciw pasożytniczym do zwalczania nicieni i ochrony przeciw nicieniom.

Rzecznik patentowy

Anna Belz