



República Federativa do Brasil

Ministério do Desenvolvimento, Indústria,
Comércio e Serviços

Instituto Nacional da Propriedade Industrial



(11) BR 102017009769-2 B1

(22) Data do Depósito: 10/05/2017

(45) Data de Concessão: 11/04/2023

(54) Título: PROCESSO SIMPLES PARA OBTENÇÃO DE INTERMEDIÁRIOS AVANÇADOS NA PREPARAÇÃO DE ANÁLOGOS LIPOFÍLICOS DO ÁCIDO GAMA-AMINOBUTÍRICO (GABA) A PARTIR DE ADUTOS DE MORITA-BAYLIS-HILLMAN

(51) Int.Cl.: C07C 205/02; C07C 205/03; C07C 205/14; C07C 205/50; A61P 25/00.

(73) Titular(es): UNIVERSIDADE FEDERAL DO RIO GRANDE - FURG.

(72) Inventor(es): MARCELO GONÇALVES MONTES D'OCA; MARIELI OLIVEIRA RODRIGUES; FELIPI RAMIRO SOBRAL.

(57) Resumo: A presente invenção prevê um processo de obtenção da forma racêmica de novos intermediários avançados do ácido gama-aminobutírico (GABA), denominados gama-nitrohidroxiésteres alfa-alquil substituídos, empregando a reação de Morita-Baylis-Hillman (MBH). Os intermediários avançados aqui propostos são substratos sintéticos para a obtenção de análogos lipofílicos do GABA, que são utilizados atualmente para o tratamento de vários tipos de doenças neurodegenerativas que estão associadas ao envelhecimento como, doença de Alzheimer, Parkinson, Huntington, esquizofrenia, também epilepsia e ansiedade, entre outras. Os compostos denominados gama-nitrohidroxiésteres alfa-alquil substituídos são obtidos em duas etapas com bons rendimentos, sendo a etapa chave a reação de Morita-Baylis-Hillman utilizando substratos com cadeias graxas constituídas de quatro a vinte e dois carbonos (C4-C22), lineares, ramificadas, saturadas, insaturadas e poli-insaturadas. A etapa chave do processo utilizada um catalisador de baixo custo e ambientalmente correto e reagentes comerciais de baixo custo. Além disto, a partir dos gama-nitrohidroxiésteres alfa-alquil substituídos, obtiveram-se as hidroxí gama-lactamas alfa-alquil substituídas análogas lipofílicas do GABA, que permitem uma nova solução para a melhoria do problema para a transposição da Barreira Hematoencefálica (BH), altamente lipofílica, e representam uma alternativa viável, suprimindo o efeito das (...).