

Warszawa, dnia 2 kwietnia 1952 r.



C07d 7/30

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ OPIS PATENTOWY

Nr 34773

Kl. 12 q, 24

Spofa, Spojeně farmaceutické závody, národní podnik
(Praga, Czechosłowacja)

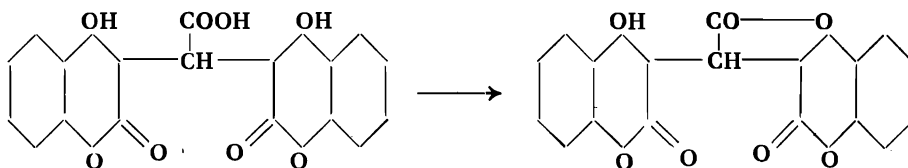
Sposób wytwarzania laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)- octowego

Udzielono z mocą od dnia 16 sierpnia 1949 r.
Pierwszeństwo: 30 grudnia 1948 r. (Czechosłowacja)

Jest rzeczą znaną, że niektóre pochodne kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego są czynne biologicznie i że zwłaszcza niektóre estry tego kwasu obniżają krzepliwość krwi.

Stwierdzono, że lakton kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego jest bardzo odpowiednim materiałem do wytwarzania tych estrów. Lakton ten,

sposobem według wynalazku, można korzystnie wytworzyć w ten sposób, że kwas bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowy, w roztworze lub w zawiesinie w obojętnym środowisku, poddaje się działaniu środków odwadniających, np. chlorku fosforu, chlorku tionylu, dwutlenku siarki, kwasu octowego i tym podobnych, zgodnie z wzorem:



Przy użyciu niektórych środków powstaje przejściowo chlorek omawianego kwasu, który to chlorek odszczepiając chlorowódz daje odpowiedni lakton.

Przykład I. Jedną część kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego miesza się z jedną częścią tlenochlorku fosforu i stosując czterochlormetan lub trójchloroetylen jako środek rozcieńczający,

ogrzewa się w ciągu około jednej godziny. Powstały krystaliczny produkt odsąca się, przy czym w ługach macierzystych można przerabiać dalszą ilość kwasu. Produkt reakcji przedstawia białą krystaliczną substancję o temperaturze topnienia 285°C , która trudno rozpuszcza się w zwykłych rozpuszczalnikach, a daje się przekrystalizować np. z cykloheksanonu.

P r z y k ł a d II. Jedną część kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego ogrzewa się w środowisku czterochlorometanu lub tróchloroetyleny z niewielkim nadmiarem równoważnej ilości chlorku tionylu. Produkt reakcji odsąca się. Przedstawia on białą krystaliczną substancję o temperaturze topnienia 285°C .

P r z y k ł a d III. 20 g kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego ogrzewa się pod chłodnicą zwrotną z 80 cm^3 kwasu octowego. Po krótkim gotowaniu z roztworu wydziela się krystaliczna substancja, będąca laktonem kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego o temperaturze topnienia 285°C .

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego, znamienny tym, że kwas bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowy poddaje się działaniu środków odwadniających.
2. Sposób według zastrz. 1. znamienny tym, że stosuje się takie środki odwadniające, które nie powodują odkarboksylowania.
3. Sposób według zastrz. 1 i 2, znamienny tym, że stosuje się środek, który umożliwia tworzenie się odpowiedniego chlorku kwasowego jako przejściowego produktu pośredniego przechodzącego wskutek odszczipienia HCl w lakton.
4. Sposób według zastrz. 1 — 3, znamienny tym, że reakcję przeprowadza się w roztworze lub w zawiesinie w obojętnym środowisku.

Spofa, Spojené farmaceutické
závody, národní podnik

Zastępca: Kolegium Rzeczników Patentowych