



Patent dodatkowy
do patentu nr 47 686

Zgłoszono: 05.III.1962 (P 98 415)

Pierwszeństwo: 26.IV.1961 Francja

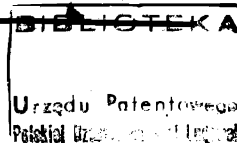
Opublikowano: 3.I.1966

Kl. 12p, 1/01

MKP C 07 d 31/48

UKD

Właściciel patentu: Rhône — Poulenc S. A., Paryż (Francja)



Sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydyny

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydyny o wzorze ogólnym 1, w którym R oznacza rodnik n-propylowy albo n-butyłowy i stanowi on rozwinięcie wynalazku opatentowego pod nr 47.686.

W opisie patentowym nr 47.686 podany jest sposób wytwarzania związku — pochodnej pirydyny o wzorze ogólnym 1, w którym R oznacza rodnik etylowy. Otrzymany tioamid kwasu S-oksy-2-etyloizonikotynowego posiada dobre działanie gruczołozastatyczne.

Obecnie stwierdzono, że pochodne o wzorze 1, w którym R oznacza rodnik n-propylowy albo n-butyłowy są również dobrymi środkami do leczenia gruźlicy, posiadają właściwości przeciwgruźlicze, w połączeniu z dobrą tolerancją gastryczną.

Te nowe pochodne wytwarza się przez utlenienie pochodnych o wzorze 2, w którym R ma znaczenie podane poprzednio.

Reakcję utleniania korzystnie prowadzi się za pomocą wody utlenionej w środowisku organicznym lub wodno-organicznym, na przykład w alkoholu rozcieńczonym wodą w temperaturze poniżej 50°.

Przytoczone przykłady, nie ograniczając wynalazku, pokazują jak stosować go w praktyce.

Przykład I. Do zawiesiny 30 g tioamidu kwasu 2-n-propyloizonikotynowego w 318 cm³ alkoholu ab-

2

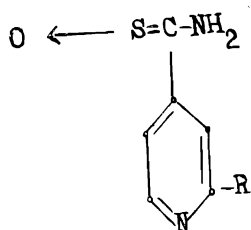
solutnego i 17 cm³ wody dodaje się w ciągu 20 minut, nie przekraczając temperatury 30°, 20 cm³ 30%-ej wody utlenionej. Miesza się w ciągu 5 godzin, po czym praktycznie nastąpiło całkowite rozpuszczenie. Dodaje się 2 g węgla w celu rozłożenia nadmiaru wody utlenionej, przesącza i zagęszcza pod próżnią 0,1 mm Hg w temperaturze poniżej 55°. Otrzymuje się 31,1 g surowego produktu.

Przez roztarcie tego produktu w izopropanolu otrzymuje się 4,75 g tioamidu kwasu S-oksy-2-n-propylonikotynowego, o temperaturze topnienia 117—118°.

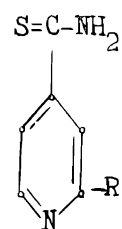
Przykład II. Operację prowadzi się w takich samych warunkach jak w przykładzie I, wychodząc z 30 g tioamidu kwasu 2-n-butylo-izonikotynowego. Otrzymuje się 35 g surowego produktu woskowego, o temperaturze topnienia około 75°.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydyny o wzorze 1, w którym R oznacza rodnik n-propylowy lub n-butyłowy, według patentu nr 47.686, **znamienny tym**, że utlenia się za pomocą wody utlenionej związek o wzorze 2, w którym R ma znaczenie podane wyżej.



WZÓR 1



WZÓR 2