

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

238400
(11) (B2)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

(22) Přihlášeno 27 02 84

(21) [PV 1363-84]

(32) (31) (33) Právo přednosti od 08 07 83
[P 1482/83] Jugoslávie

(40) Zveřejněno 14 12 84

(45) Vydáno 15 04 87

(51) Int. Cl.⁴
C 07 D 417/12

(72)
Autor vynálezu

ŠKET BORIS dr.-ing., LJUBLJANA, ZUPET PAVEL Mag.-ing.,
NOVO MESTO, ZUPAN MARKO dr.-ing., LJUBLJANA,
GLOBOKAR MARJETA dipl.-ing., NOVO MESTO, JAPELJ MIHA dr.-ing.,
NOVO MESTO [Jugoslávie]

(73)
Majitel patentu

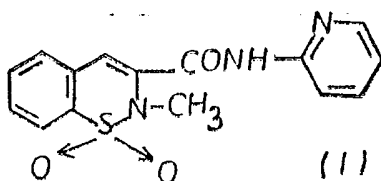
KRKA, TOVARNA ZDRAVIL, N.SOL.O., NOVO MESTO [Jugoslávie]

(54) Způsob výroby N-(2-pyridyl)-2-methyl-4-hydroxy-2H-1,2-benzothiazin-3-karboxamid-1,1-dioxidu

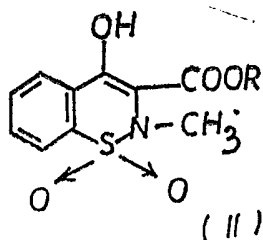
1

2

Předmětem vynálezu je nový způsob výroby N-(2-pyridyl)-2-methyl-4-hydroxy-2H-1,2-benzothiazin-3-karboxamid-1,1-dioxidu vzorce I



tak, že se uvede v reakci sloučenina obecného vzorce II



s 2-aminopyridin-1-N-oxidem v inertním rozpouštědle.

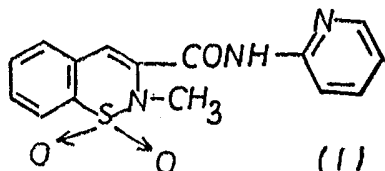
Sloučenina vzorce I je známý protizánětlivý prostředek nesteroidní povahy a mimoto má analgetický a antipyretický účinek.

Tutéž sloučeninu je možno získat rovněž analogickým způsobem tak, že se užije jako výchozí látka sloučenina obecného vzor-

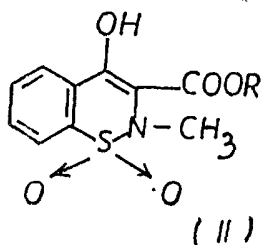
ce II, v němž R znamená ethyl, propyl nebo terc.butyl.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob výroby N-(2-pyridyl)-2-methyl-4-hydroxy-2H-1,2-benzothiazin-3-karboxamid-1,1-dioxidu vzorce I

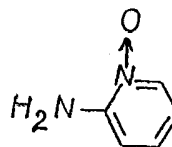


vyznačující se tím, že se uvede v reakci alkyl-(4-hydroxy-2-methyl-2H-1,2-benzothiazin-3-karboxylát)-1,1-dioxid obecného vzorce II



kde

R znamená alkylový zbytek o 1 až 4 atomech uhlíku, s 2-aminopyridin-1-N-oxidem vzorce III



(III)

v inertním organickém rozpouštědle.

2. Způsob podle bodu 1, vyznačující se tím, že se jako inertního organického rozpouštědla užije xylenu.

3. Způsob podle bodů 1 a 2, vyznačující se tím, že se amidace provádí při teplotě varu reakční směsi pod zpětným chladičem.