



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

208000

(11)

(B1)

(22) Přihlášeno 15 05 79
(21) (PV 3309-79)

(40) Zveřejněno 28 11 80

(45) Vydáno 01 12 82

(51) Int. Cl.³

C 07 C 93/06

// A 61 K 31/135

(C 07 C 93/06, 49/84)

C 07 D 213/16

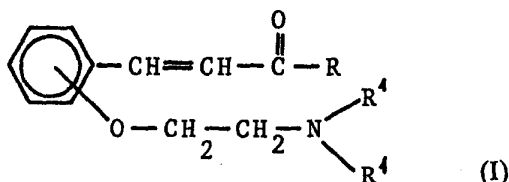
(75)

Autor vynálezu

BRÁDLEROVÁ ALENA RNDr. a ŽURINDA JÁN RNDr. PhMr. CSc.,
BRATISLAVA

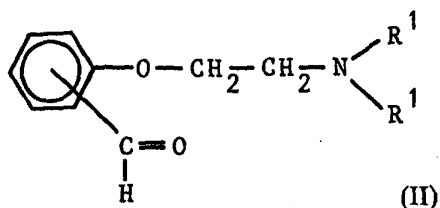
(54) Azachalkony a způsob jejich přípravy

Vynález se týká azachalkonů obecného vzorce I,

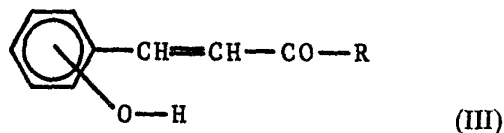


kde R znamená 3-, resp. 4-pyridyl, R¹ znamená methyl nebo ethyl. U známých strukturálně příbuzných sloučenin byl popsán vasodilatační, antihypertenzní, antihistaminový, choleretický a antimikrobiální účinek. Tyto sloučeniny se nejčastěji připravují reakcí příslušných aldehydů s ketony za použití zásaditého katalyzátoru (KOH, NaOH).

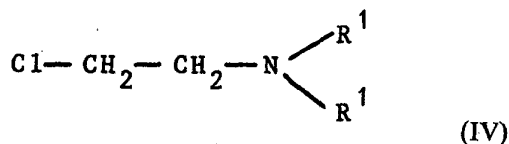
Nevýhody použití anorganických hydroxidů jako katalyzátorů pro přípravu azachalkonů uvedeného typu odstraňuje způsob podle vynálezu, kde se nechá reagovat příslušný 2-dialkylaminoethoxybenzaldehyd obecného vzorce II, kde R¹ má stejný



význam jako ve vzorci I, s 3- nebo 4-acetylpyridinem v prostředí pyridinu při teplotě místnosti po dobu 48 h za katalýzy diethylaminem nebo se nechá reagovat sodná sůl hydroxyazachalkonu obecného vzorce III, kde R má stejný význam jako



ve vzorci I, s 2-chlorethylodialkylaminem obecného vzorce IV, kde R¹ má stejný význam jako ve vzorci



I, v roztoku toluenu při teplotě tvaru rozpouštědla po dobu 4 h bez katalyzátoru. Všechny sloučeniny, které jsou předmětem vynálezu, jsou nové, v literatuře dosud nepopsané. Předpokládá se jejich využití v oblasti sloučenin působících na kardiovaskulární systém, vykazují také průměrnou antibakteriální aktivitu.

Na ilustraci sloučenin a způsobu jejich přípravy se uvádějí příklady provedení.

Příklad 1

0,1 molu 2-(dimethylaminoethoxy)benzaldehydu se rozpustí ve 20 ml suchého pyridinu, přidá se 0,1 molu 4-acetylpyridinu a 0,1 molu diethylaminu. Směs se nechá stát při teplotě místnosti 48 h. Po ukončení reakce se prchavé složky odpaří a z olejovitého zbytku se připraví soli.

2-(2-dimethylaminoethoxy)-4'-azachalkon · HCl, výtěžek 72 %, teplota tání 167 až 168 °C (bezvodý ethanol).

Příklad 2

Pracovní postup je stejný jako v příkladu 1, výchozí sloučeniny jsou 4-(2-dimethylaminoethoxy)benzaldehyd a 3-acetylpyridin. 4-(2-Dimethylaminoethoxy)-3'-azachalkon je pevná látka, výtěžek 52 %, t.t. 79,5 až 80 °C (petroléter).

Příklad 3

Pracovní postup je stejný jako v příkladu 1, výchozí sloučeniny jsou 3-(2-diethylaminoethoxy)benzaldehyd a 4-acetylpyridin. 3-(2-Diethylaminoethoxy)-4'-azachalkoncitrát, výtěžek 76 %, t.t. 168 až 170,5 °C (bezvodý methanol).

Příklad 4

2,3 g sodíku se rozpustí ve 250 ml absolutního ethanolu, přidá se 0,1 molu 2-hydroxy-3'-azachalkonu a směs se mechanicky třepe 2 h při teplotě místnosti. Po oddestilování ethanolu se pevný podíl promyje etherem. K sodné soli 2-hydroxy-3'-azachalkonu se přidá 0,1 molu 2-chlorethyl-diethylaminu ve 250 ml suchého toluenu a směs se zahřívá k varu pod zpětným chladičem 4 h. Po ochlazení se zfiltruje, toluen se vakuově oddestiluje. 2-(2-Diethylaminoethoxy)-3'-azachalkon se izoluje ve formě soli s kyselinou citronovou, výtěžek 74 %, t.t. 140 až 143 °C (bezvodý methanol).

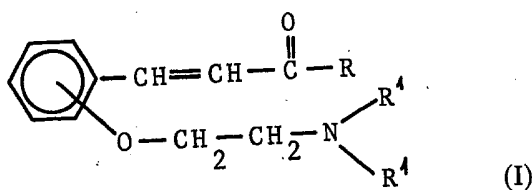
Příklad 5

Pracovní postup je stejný jako v příkladu 4, výchozí sloučeniny jsou 4-hydroxy-3'-azachalkon a 2-chlorethyl-diethylamin. 4-(2-Diethylaminoethoxy)-3'-azachalkon je pevná látka, výtěžek 51 %, t.t. 43 až 45 °C (petroléter).

Všechny sloučeniny, které jsou předmětem vynálezu, byly připraveny v 50 až 80 % výtěžcích a jejich struktura byla ověřena elementární analýzou (uhlík, vodík a dusík), a vyhodnocením ultrafialových, infračervených a ¹H NMR spekter.

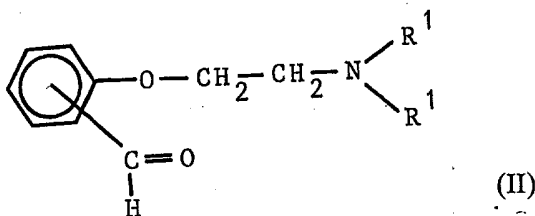
PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Azachalkony obecného vzorce I, kde R zna-



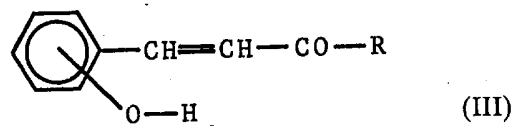
mená 3- nebo 4-pyridyl a R¹ znamená methyl nebo ethyl.

2. Způsob přípravy azachalkonů obecného vzorce I podle bodu 1, vyznačený tím, že se nechá reagovat 2-dialkylaminoethoxybenzaldehyd obecného vzorce II, kde R¹ má stejný význam jako

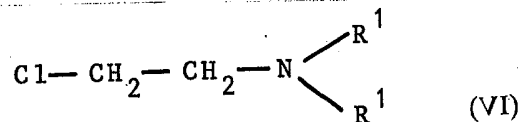


v bodě 1, s 3- nebo 4-acetylpyridinem v prostředí pyridinu za použití diethylaminu jako katalyzátoru při teplotě místnosti po dobu 48 hodin.

3. Způsob přípravy azachalkonů obecného vzorce I podle bodu 1, vyznačený tím, že se nechá reagovat sodná sůl 2-, resp 4-hydroxy-3'-nebo 4'-azachalkonu obecného vzorce III, kde R má



stejný význam jako v bodě 1, s 2-chlorethyl-dialkylaminem obecného vzorce IV, kde R¹ má stejný



význam jako v bodě 1, v toluenovém roztoku při teplotě varu rozpouštědla po dobu 4 hodin.