

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

79024

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 14.12.1972 (P. 159 516)

Pierwszeństwo: _____

Zgłoszenie ogłoszono: 01.06.1973

Opis patentowy opublikowano: 10.06.1975

Kl. 12q,24

MKP C07d 87/00



Twórcy wynalazku: Kazimierz Samuła, Ewa Jurkowska-Kowalczyk, Bożenna Cichy,
Zofia Trojanowska, Anna Muszalska, Stanisława Spychała

Uprawniony z patentu tymczasowego: Instytut Przemysłu Farmaceutycznego,
Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydylochromanonu

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydylochromanonu o wzorze ogólnym 1, w którym R oznacza atom wodoru, niższą grupę alkilową lub niższą grupę alkoksylową.

Pochodne te są związkami nowymi, dotychczas nieopisanymi w literaturze, będącymi półproduktami do syntezy związków o działaniu leczniczym.

Według wynalazku pochodne pirydylochromanonu o wzorze ogólnym 1 otrzymuje się z azachalkonu o wzorze ogólnym 2, w którym R ma podane wyżej znaczenie, w wyniku kondensacji z jednoczesną cyklizacją. Azachalkon poddaje się ogrzewaniu w temperaturze 100 do 250° w obecności stężonych kwasów nieorganicznych takich jak kwas fosforowy lub polifosforowy, po czym produkt wyodrębnia się i oczyszcza w znany sposób.

Przykład. 25,5 g (0,1 mola) 1-(2-hydroksy-4-metoksyfenylo)-3-(4-pirydylo)-propanonu-1 zadano 50 ml kwasu fosforowego po czym mieszaninę ogrzewano w temperaturze 180° przez 8 godzin. Następnie mieszaninę rozcieńczono wodą i zobojętniono roztworem amoniaku. Surowy osad 1-(2-hydroksy-4-metoksyfenylo)-2-[2'-(7'-metoksy)-2'-(4-pirydylo)-chromanon-4]-3-(4-pirydylo)-propanonu-1 przekrystalizowano z etanolu. Otrzymano 20 g (78% wydajności) związku o temperaturze topnienia 218–219°.

Analiza dla wzoru $C_{30}H_{20}N_2O_6$

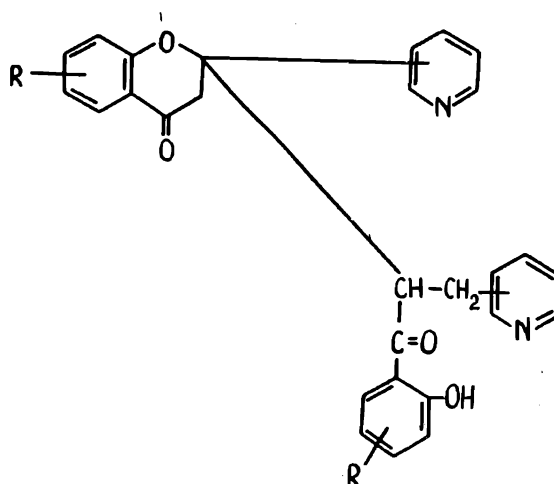
Obliczono: C = 70,59%, H = 5,10%, N = 5,49%,

Otrzymano: C = 70,68%, H = 5,17%, N = 5,18%.

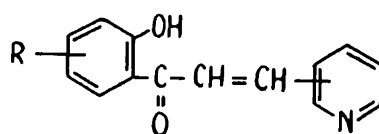
Strukturę związku ustalono na podstawie widm spektroskopowych IR, NMR i spektrografu masowego.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowych pochodnych pirydylochromanonu o wzorze ogólnym 1, w którym R oznacza atom wodoru, niższą grupę alkilową lub niższą grupę alkoksylową, znamienny tym, że azachalkon o wzorze ogólnym 2, w którym R ma podane wyżej znaczenie, poddaje się ogrzewaniu w temperaturze 100 do 250° w obecności stężonych kwasów nieorganicznych takich jak kwas fosforowy lub polifosforowy po czym produkt wyodrębnia się i oczyszcza w znany sposób.



Wzór 1



Wzór 2

