

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(18)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

259821
(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴
C 07 C 103/76

(22) Přihlášeno 01 09 86
(21) [PV 6329-86.Q]

(40) Zveřejněno 15 03 88

(45) Vydáno 15 03 89

(75)

Autor vynálezu

ŠTROF JIŘÍ, SMRŽ RUDOLF ing. CSc., DEJMEK LUBOŠ ing. RNDr. CSc.,
ZOULA VÁCLAV, PRAHA

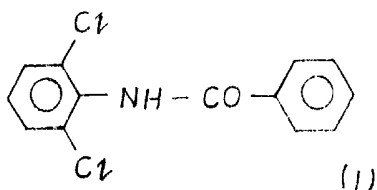
(54) 2,6-dichloranilid kyseliny benzoové

1

2

Řešení se týká 2,6-dichloranilidu kyseliny benzoové; tato nová látka slouží jako mezi-produkt pro přípravu sodné soli diclofenacu, která je žádaným léčivem s protibolestivým a protizánětlivým účinkem.

Vynález se týká 2,6-dichloranilidu kyseliny benzoové vzorce I



který je meziproduktem přípravy a-(2,6-dichloranilino)-fenyloctové kyseliny, jejíž sodná sůl (diclofenac natrium) je rozšířeným léčivem s protibolestivým a protizánětlivým účinkem.

Nová sloučenina vzorce I se připravuje reakcí 2,6-dichloranilinu s benzoylchloridem za přítomnosti ekvivalentního množství pyridinu nebo terciárního aminu jako protonakceptoru, v rozmezí teplot 20° až 110° Celsia; po zředění reakční směsi vodou se vyloučený surový 2,6-dichloranilid kyseliny benzoové t. t. 147° až 149° C izoluje filtrací.

Čistý 2,6-dichloranilid kyseliny benzoové jako bílá krystalická látka t. t. 149° až 150° Celsia, čistoty 99,93% (stanoveno plynovou chromatografií) se získá krystalizací z methanolu.

Následující příklad přípravy sloučeniny podle vynálezu látku pouze dokládá, ale nemezuje.

Příklad

Směs 16,2 g (0,10 molu) 2,6-dichloranilinu, 15,5 g (0,11 molu) benzoylchloridu a 50 ml pyridinu se za stálého míchání zahřívá 2 hod. na teplotu 100° C; vzniklá hnědá reakční směs se ponechá zchladnout na 20° C a za míchání se zředí 250 ml dest. vody. Vyloučená hnědá sraženina surového 2,6-dichloranilidu kyseliny benzoové se odsaje, promyje 150 ml dest. vody a usuší do konst. hmotnosti; získá se 22,3 g produktu tj. 82,1 % th. 98% čistoty (stanoveno plynovou chromatografií). Krystalizací surového produktu ze 150 ml methanolu se získá 17,0 g čistého (99,93%) 2,6-dichloranilidu kyseliny benzoové, bílé krystalické látky t. t. 149° až 150° C (Koffler).

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

2,6-dichloranilid kyseliny benzoové vzorce I

