



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU 206 621

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

(61)

(23) Výstavní priorita
(22) Přihlášeno 26 01 78
(21) PV 537-78

(11) (B 1)

(51) Int. Cl.³

C 07 C 133/04

(40) Zveřejněno 15 09 80
(45) Vydáno 15 12 83

(75)

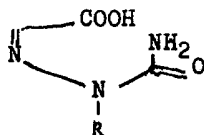
Autor vynálezu NOVÁČEK ALOIS doc. ing. DrSc., SEDLÁČKOVÁ VENUŠE ing., VONDRÁČEK BOHUMÍR ing.,
ÚSTÍ NAD LABEM, ŠEVČÍK BOHUMIL doc. MVDr. DrSc., POHOŘÍ, BEDRNÍK PETR RNDr. CSc. a
GUT JIŘÍ dr. ing. DrSc., PRAHA

(54)

Způsob výroby substituevaných 2-benzylderivátů semikarbazonu kyseliny glyoxylové

1

Vynález se týká způsobu výroby substituevaných 2-benzylderivátů semikarbazonu kyseliny glyoxylové obecného vzorce I

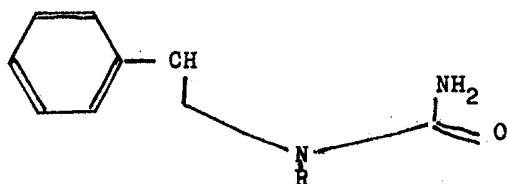


/I/

ve kterém R je benzyl, popřípadě v aromatickém jádře jedním nebo dvěma atomy chlóru substituevaný benzyl, zejména 4-chlor-, 3-chlor- nebo 3,4-dichlorbenzyl.

Jak bylo zjištěno, jsou tyto deriváty výhodnými výchozími látkami pro přípravu substituevaných benzylderivátů 6-azauracilu, z nichž zejména chlorem substituevané 1-benzyl-deriváty se vyznačují pozoruhodným účinkem proti karcinogene drůbeže.

Podle vynálezu se deriváty obecného vzorce I připravují tak, že se na 2-benzylderiváty 1-benzylidensemikarbazidu obecného vzorce II



/II/

ve kterém R je totéž jako ve vzorci I, působí kyselinou glyoxylovou ve vodném prostředí za přítomnosti katalytického množství minerální kyseliny, s výhodou kyseliny sírové, při teplotě od 50 °C až k teplotě varu reakční směsi.

Výhodou způsobu podle vynálezu je to, že je jednoduchý a že umožňuje snadnou přípravu libovolných 2-benzylderivátů kyseliny glyoxylové v dobrých výtěžcích a v uspokojivé čistotě. Je snadno realizovatelný v provozním měřítku a proto vhodný pro získání poloпродукtů kalcidiostaticky účinných 1-benzylderivátů 6-azauracilu.

Podrobnosti vyplývají z příkladů provedení.

Příklad 1

Rožtek 3,7 g /0,05 mol/ kyseliny glyoxylové v 600 ml vody byl ekyselen 2,5 ml konc. kyseliny sírové a potom bylo přidáno 12,6 g /0,05 mol/ 2-benzyl-1-benzylidensemikarbazidu. Reakční směs byla zahřáta k varu a postupně byl oddestilován benzaldehyd. Potom byl rožtek zahuštěn na 1/3 původního objemu, ochlazen na 10 °C a vyloučený 2-benzylsemikarbazon kyseliny glyoxylové byl odsát, promyt vodou a překrystalován ze zředěného ethanolu. Výtěžek 7,8 g /70,5 % teorie/ 2-benzylsemikarbazonu kyseliny glyoxylové s t.t. 199 až 203 °C.

Příklad 2

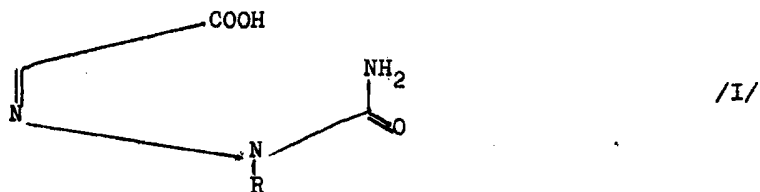
Rožtek 3,7 g /0,005 mol/ kyseliny glyoxylové v 600 ml vody byl ekyselen 2,5 ml konc. kyseliny sírové a potom bylo přidáno 96,1 g /0,05 mol/ 2-/3,4-dichlorbenzyl/-1-benzylidensemikarbazidu. Postupem jako v příkladu 1 bylo získáno 9,86 g /68 % teorie/ 2-/3,4-dichlorbenzyl/semikarbazonu kyseliny glyoxylové s t.t. 193 až 197 °C.

Příklad 3

Rožtek 3,7 g /0,05 mol/ kyseliny glyoxylové v 600 ml vody byl ekyselen 2,5 ml konc. kyseliny sírové a potom bylo přidáno 14,35 g /0,05 mol/ 2-/3-chlorbenzyl/-1-benzylidensemikarbazidu a dále postupováno jako v příkladu 1. Bylo získáno 8,79 g /69 % teorie/ 2-/3-chlorbenzyl/semikarbazonu kyseliny glyoxylové s t.t. 190 až 194 °C.

P R Ě D M Ě T V Y N Á L E Z U

Způsob výroby substituevaných 2-benzylderivátů semikarbazonu kyseliny glyoxylové obecného vzorce I



ve kterém R je benzyl, popřípadě v aromatickém jádře jedním nebo dvěma atomy chloru substituevaný benzyl, zejména 4-chlor, 3-chlor nebo 3,4-dichlorbenzyl, vyznačující se tím, že se na 2-benzylderiváty 1-benzylidensemikarbazidu obecného vzorce II



ve kterém R je totéž co ve vzorci I, působí kyselinou glyoxylovou ve vodném prostředí, za přítomnosti katalytického množství minerální kyseliny, s výhodou kyseliny sírové, při teplotě od 50 °C až k teplotě varu reakční směsi.