



Patent dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 30.01.68 (P. 159966)

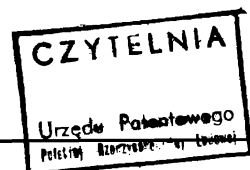
Pierwszeństwo: 09.01.68 Stany
Zjednoczone
Ameryki

Zgłoszenie ogłoszono: 30.09.73

Opis patentowy opublikowano: 30.12.1976

MKP C07d 49/38
C07d 99/10

Int. Cl²
C07D 233/54



Twórca wynalazku: _____

Uprawniony z patentu: Merck and Co. Inc. Rahway, New Jersey (Sta-
ny Zjednoczone Ameryki)

Sposób wytwarzania nowych pochodnych benzimidazolu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych benzimidazolu o ogólnym wzorze 1, w którym R_1 oznacza rodnik tiazolilowy, a R_2 oznacza niższą grupę alkiloksyłową lub alkilotio, grupę fenoksyłową, niższą grupę alkiloaminową lub dwualkiloaminową, grupę fenyloaminową albo grupę cykloalkiloaminową o 5 lub 6 członach w pierścieniu.

Związki wytwarzane sposobem według wynalazku mają cenne właściwości robakobójcze.

We wzorze 1 symbol R_1 oznacza korzystnie rodnik 4-tiazolilowy, zaś rodniki alkilowe w grupach alkiloksyłowych, alkilotio, alkilo- lub dwualkiloaminowych zawierają korzystnie 1—5 atomów węgla, a grupy cykloalkiloaminowe o 5 lub 6 członach w pierścieniu oznaczają korzystnie grupy 1-pirolidynowe lub 1-piperydynowe.

Sposób wytwarzania związków o ogólnym wzorze 1, w którym R_1 i R_2 mają wyżej podane znaczenie, polega według wynalazku na tym, że związek o ogólnym wzorze 2, w którym R_1 ma wyżej podane znaczenie, poddaje się reakcji ze związkiem o ogólnym wzorze 3, w którym R_2 ma wyżej podane znaczenie, a Y oznacza atom chloru. Reakcję prowadzi się w ten sposób, że do zawiesiny aminobenzimidazolu o wzorze 2 w odpowiednim rozpuszczalniku organicznym, zwłaszcza w pirydynie, dodaje się mieszając w temperaturze pokojowej związek

2

o wzorze 3. Reakcja trwa zwykle 1—3 godzin po czym produkt wytrąca się z mieszaniny reakcyjnej przez dodanie wody, odsącza i oczyszcza znanymi sposobami, na przykład przez przekrystalizowanie.

Związki o wzorze 2 i 3, stosowane jako produkty wyjściowe, są związkami znanymi lub wytwarza się je sposobami analogicznymi do znanych.

Wynalazek jest zilustrwany w następującym przykładzie.

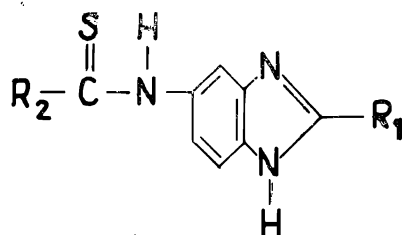
Przykład. Do zawiesiny 4,32 g 5-amino-2-(4'-tiazolilo)-benzimidazolu w 25 ml pirydyny wkrapla się mieszając 3,62 g chlorku fenoksytiokarbonylu i miesza w ciągu 1 1/2 godziny, po czym do otrzymanego roztworu dodaje się wody i odsącza otrzymany osad. Produkt ten przekrystalizowuje się z metanolu, otrzymując 5-fenoksytiokarbonyloamino-2-(4'-tiazolilo)-benzimidazol o temperaturze topnienia 155—157°C.

Zastrzeżenie patentowe

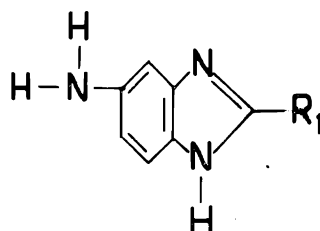
Sposób wytwarzania nowych pochodnych benzimidazolu o ogólnym wzorze 1, w którym R_1 oznacza rodnik tiazolilowy, a R_2 oznacza niższą grupę alkiloksyłową lub alkilotio, grupę fenoksyłową, niższą grupę alkiloaminową lub dwualkiloaminową, grupę fenyloaminową albo grupę cykloalkiloami-

nową o 5 lub 6 członach w pierścieniu, **znamienny tym**, że związek o ogólnym wzorze 2, w którym R_1 ma wyżej podane znaczenie, poddaje się

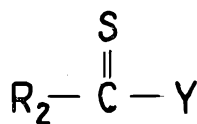
reakcji ze związkiem o ogólnym wzorze 3, w którym R_2 ma wyżej podane znaczenie, a Y oznacza atom chlorowca.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3