



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

224 248

(11)

(B1)

(61)

(23) Výstavní priorita

(22) Přihlášeno 08 07 82

(21) PV 5236-82

(51) Int. Cl.³ C 07 D 495/04

(40) Zveřejněno 25 03 83

(45) Vydáno 01 09 84

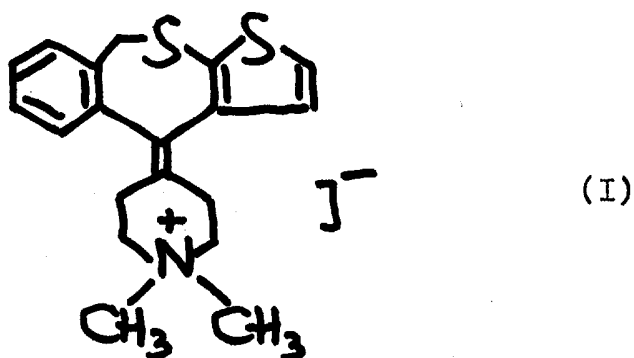
(75)

Autor vynálezu POLÍVKA ZDENĚK ing. CSc., PRAHA

PROTIVA MIROSLAV dr. ing. DrSc., PRAHA

(54) Způsob přípravy nové kvarterní amoniové soli

Vynález se týká způsobu přípravy nové kvarterní amoniové soli vzorce I.



Látka vzorce I, tj. 1,1-dimethyl-4-(4,9-dihydrothieno[2,3-c]-2-benzothiepin-4-yliden)piperidiniumjodid, je jednak meziproduktem přípravy neurotropně a psychotropně účinných léčiv, jednak má sama o sobě anticholinergickou a spasmolytickou účinnost, což z ní činí rovněž potenciální léčivo.

Způsob přípravy látky I podle tohoto vynálezu spočívá v reakci 4-(1-methyl-4-piperidyliden)-4,9-dihydrothieno(2,3-c)-2-benzothiepinu (Rajšner M. a spol., Collect.Czech.Chem.Comm. 32, 2854, 1967) s malým přebytkem methyljodidu v methanolu. Produkt je krystalický s charakteristickou vysokou teplotou tání 295 až 298 °C. Jeho identita byla zajištěna analýsami.

Látka vzorce I podle vynálezu se připraví tímto způsobem : K roztoku 6,3 g 4-(1-methyl-4-piperidyliden)-4,9-dihydrothieno[2,3-c]-2-benzothiepinu ve 120 ml methanolu se přidá 3,0 g methyljodidu a směs se ponechá v klidu 5 h při teplotě místnosti. Potom se vaří 5 min pod zpětným chladičem a ponechá dalších 16 h v klidu při teplotě místnosti. Po této době vyloučený olej se rozpustí zahřátím a přidávkou dalších 30 ml methanolu, teplý roztok se zfiltruje s uhlím a filtrát se zředí 30 ml etheru. Krysta-

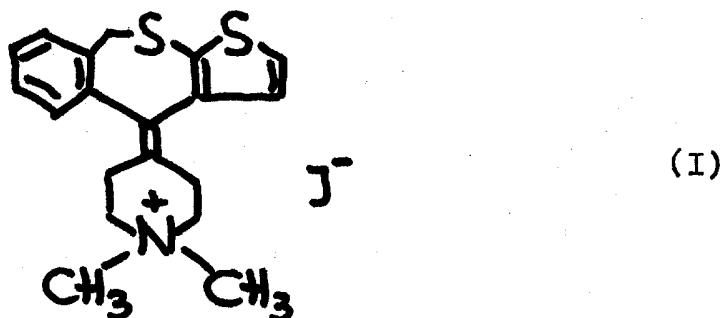
224 248

lisací v ledničce se získá 8,2 g (90 %) 1,1-dimethyl-4-(4,9-dihydrothieno[2,3-c]-2-benzothiepin-4-yliden) piperidiniumjodidu (I) tajícího při 282 až 288 °C. Rekrystalisací ze směsi vodného methanolu a etheru se získá čistá látka tající při 295 až 298 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

224 248

Způsob přípravy nové kvarterní amoniové soli vzorce I,



tj. 1,1-dimethyl-4-(4,9-dihydrothieno[2,3-c]-2-benzothiepin-4-yliden)piperidiniumjodidu, vyznačující se tím, že 4-(1-methyl-4-piperidylden)-4,9-dihydrothieno[2,3-c]-2-benzothiepin se podrobí reakci s mírným přebytkem methyljodidu v methanolu.