

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY PATENTU TYMCZASOWEGO

73451

Patent tymczasowy dodatkowy
do patentu nr _____

Kl. 12q,24

Zgłoszono: 30.10.1972 (P. 158550)

MKP C07d 5/16

Pierwszeństwo _____

Zgłoszenie ogłoszono: 01.06.1973

Opis patentowy opublikowano: 10.02.1975

CZYTELNIA

Urzędu Patentowego
Polskiej Rzeczypospolitej Ludowej

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

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

Sposób wytwarzania nowych pochodnych benzofuranonu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych benzofuranonu o wzorze ogólnym 1, w którym R oznacza atom wodoru, niższą grupę alkilową lub niższą grupę alkoksylową. Pochodne te mogą znaleźć zastosowanie jako produkty pośrednie w syntezie związków o działaniu leczniczym.

Według wynalazku azachalkon o wzorze ogólnym 2, w którym R ma podane wyżej znaczenie, poddaje się ogrzewaniu w temperaturze 50—200°C w obecności stężonych kwasów nieorganicznych, takich jak kwas solny i kwas fosforowy, oraz w ewentualnej obecności rozpuszczalnika organicznego, takiego jak niższy alkohol, po czym produkt wyodrębnia się i oczyszcza w znany sposób.

Przykład I. 22,5 g (0,1 mola) i 1-2-hydroksyfenylo/-3-/4-pirydylo/-propanonu-1 rozpuszczono w 100 ml metanolu, dodano 50 ml stęż. kwasu solnego i ogrzewano na łaźni wodnej przez 16 godzin w temperaturze wrzenia mieszaniny reakcyjnej. Następnie oddestylowano metanol, a pozostałość zobojętniono roztworem amoniaku. Wytrącony surowy 1-/2-hydroksyfenylo/-2-/2'-benzofuranono-3'-/2'-γ-pikolilo/-3-/4-pirydylo/-propanon-1 przekrystalizowano z metanolu. Otrzymano 18 g (80% wydajności) krystalicznego związku o temperaturze topnienia 228—229°C.

Analiza dla wzoru $C_{28}H_{22}N_2O_6$:

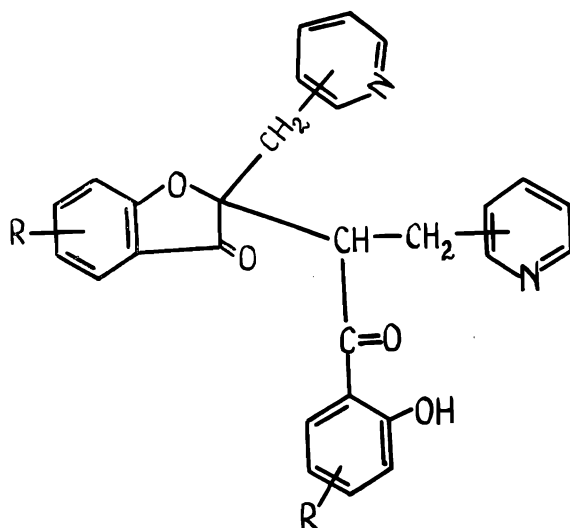
2

Obliczono C 74,87%; H 4,89%; N 6,22%;
otrzymano: C 74,50%; H 4,96%; N 6,07%.

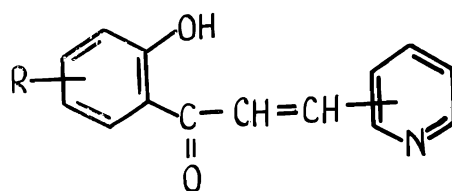
Przykład II. 22,5 g (0,1 mola) 1-/hydroksy-fenylo/-3-/4-pirydylo/-propanonu-1 zadano 50 ml stężonego kwasu fosforowego, po czym mieszaninę ogrzewano w temperaturze 120°C przez 8 godzin. Następnie mieszaninę rozcieńczono wodą i zobojętniono roztworem amoniaku. Wytrącony surowy 1-/2-hydroksyfenylo/-2-/2'-benzofuranono-3'-/2'-γ-pikolilo/-3-/4-pirydylo/-propanon-1 przekrystalizowano z metanolu. Otrzymano 19,3 g (86% wydajności) związku o temperaturze topnienia 228—229°C. Wyniki analizy elementarnej analogiczne jak w przykładzie I.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowych pochodnych benzofuranonu 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 50—200°C w obecności stężonych kwasów nieorganicznych, takich jak kwas solny i kwas fosforowy, oraz w ewentualnej obecności rozpuszczalnika organicznego, takiego jak niższy alkohol, po czym produkt wyodrębnia się i oczyszcza w znany sposób.



Wzór 1



Wzór 2