

15 lutego 1928 r.

COtd 29/24

URZĄD PATENTOWY



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIŚ PATENTOWY

Nr 8168.

Kl. 12 p 1.

I. G. Farbenindustrie Aktiengesellschaft
(Frankfurt n. M., Niemcy).

Sposób otrzymywania pochodnych kwasowych estru kwasu α - α' -dwumetylo- γ -oksy-piperydino- β -karbonowego.

Zgłoszono 26 kwietnia 1927 r.

Udzielono 15 grudnia 1927 r.

Pierwszeństwo: 17 maja 1926 r. (Niemcy).

Wykryto, że estry aromatyczne estru kwasu α - α' - dwumetylo - γ - oksypiperydino - β - karbonowego, które otrzymuje się zapomocą estryfikowania tego estru w sposób znany kwasami aromatycznymi są środkami znieczulającymi lokalnymi o wyróżniających się własnościach, które to ciała z jednej strony są pod względem działania bardzo zbliżone do kokainy, wykazując w porównaniu z tą ostatnią mniejsze działanie trujące, z drugiej zaś strony przewyższają kilkakrotnie *p*-amino-benzoylo - dwumetyloaminoatanol.

Ester kwasu α - α' - dwumetylo - γ - oksypiperydino - β - karbonowego otrzymuje się zapomocą redukcji odnośnego piperidonu tworzącego przy kondensa-

cji 2 moli aldehydu octowego z amoniakiem i solą dwupotasową estru kwasu acetonodwukarbonowego lub zapomocą wewnętrznej kondensacji estrowej estru kwasu β - β - iminodwukarbonowego.

Przykład. 10 części estru metylowego kwasu α - α' - dwumetylo - β - karbonowego (białe kryształy o punkcie topl. 143°) ogrzewa się na łaźni parowej pod chłodnicą zwrotną z 10 cz. chloroformu i 30 cz. chlorku benzoylowego w ciągu 15 godzin. Po ochłodzeniu zadaje się 40 cz. wody i 20 cz. eteru i miesza dokładnie.

Główna część chlorowodoru związku benzoylowego osadza się przytem w postaci kryształów. Sól odsacza się, przemy-

wa eterem, suszy i przekrystalizowuje z mieszaniny alkoholu metylowego i estru octowego. Sól topi się w temperaturze 206°. Pozostałe po odsączeniu chlorowodoru ku ługi wodne wyklóca się eterem, w celu usunięcia nadmiaru chlorku benzoylowego i otrzymuje z nich po zadaniu roztworem sodowym, wyciągnięciu eterem i przeprowadzeniu w chlorowoderek dalsze ilości opisanej powyżej soli. Wodny roztwór chlorowodoru ma odczyn obojętny, alkalia osadzają go jako zasadę w postaci olejku. Podobnie przebiega benzoylowanie bezwodnikiem kwasu benzoowego.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób otrzymywania kwasowych pochodnych aromatycznych estru kwasu α, α' - dwumetylo - γ - oksypiperydyno - β - karbonowego, znamieny tem, że ester kwasu $\alpha - \alpha'$ - dwumetylo - γ - oksypiperydyno - β - karbonowego estryfikuje się w sposób znany kwasami aromatycznymi.

I. G. Farbenindustrie
Aktiengesellschaft.
Zastępca: M. Skrzypkowski,
rzecznik patentowy.