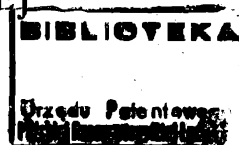




COAd 93/14

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY



Nr 42847

Kl. 12p, 4

Société des Usines Chimiques Rhône-Poulenc

Paryż, Francja

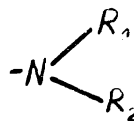
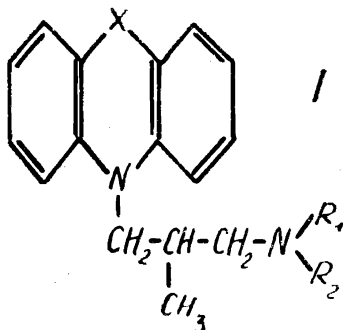
Sposób wytwarzania pochodnych fenotiazyny

Patent dodatkowy do patentu nr 42846

Patent trwa od dnia 17 lipca 1956 r.

Pierwszeństwo: 22 października 1955 r. (Francja).

W patencie nr 42846 opisano sposób otrzymywania pochodnych fenotiazyny o wzorze ogólnym



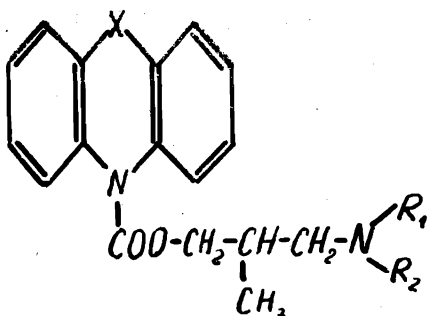
ru lub niższe rodniki alkilowe, zawierające powyżej 4 atomy węgla. Poza tym grupa

może też oznaczać rodnik heterocykliczny pyrolidynowy, piperidynowy lub morfolinowy.

Pochodne fenotiazyny o wzorze (I) posiadają w bardzo wysokim stopniu właściwości wzmacniania działania znieczulającego, właściwości nasenne lub znieczulające i wykazują również wybitne działanie antyhistaminowe i spazmolytyczne.

ich soli i ich czwartorzędowych pochodnych amoniowych. We wzorze tym X oznacza atom siarki lub rodnik $-SO-$ lub $-SO_2-$, a R_1 i R_2 są identyczne lub różne i oznaczają atomy wodo-

Wynalazek dotyczy nowego sposobu otrzymywania opisanych związków, polegającego na tym, że 10-fenotiazynylokarboksylan aminoalkoholu o wzorze ogólnym



w którym poszczególne symbole mają znaczenie podane wyżej, rozkłada się za pomocą ciepła.

Rozkład 10-fenotiazynylokarboksylanu aminoalkoholu przeprowadza się w temperaturze wyższej aniżeli 100°C , najlepiej w temperaturze między 150°C a 220°C . Stosowanie wyższych temperatur nie jest korzystne, gdyż otrzymuje się wówczas produkty reakcji bardziej zabarwione. Reakcję można przeprowadzać ogrzewając związek wyjściowy sam bez rozpuszczalnika, lub też w obojętnym rozpuszczalniku takim jak olej wazelinowy, dwufenyl, tlenek dwufenylu lub klasyczne rozpuszczalniki dekarboksylujące, jak na przykład chinolina lub inne słabe zasady.

10-fenotiazynylokarboksylany aminoalkoholi można otrzymać za pomocą znanych metod, na przykład działaniem halogenku lub estru kwasu 10-fenotiazynylokarboksylowego na odpowiedni aminoalkohol albo działaniem 10-fenotiazynylokarboksylanu chlorowcoalkilu na aminę drugorzędową albo też działaniem odpowiedniej fenotiazyny na chlorowęglan aminoalkoholu.

Szczególnie korzystny sposób, nie wymagający wydzielania w stanie czystym pośredniego 10-fenotiazynylokarboksylanu aminoalkoholu, polega na ogrzewaniu 10-fenotiazynylokarboksylanu etylowego z aminoalkoholem. Reakcja zachodzi wówczas w dwóch fazach, które mogą ewentualnie przebiegać równocześnie i które polegają na eliminowaniu alkoholu i tworzeniu się 10-fenotiazynylokarboksylanu aminoalkoholu oraz na wydzielaniu się bezwodnika kwasu węglowego z utworzeniem pożądanego produktu.

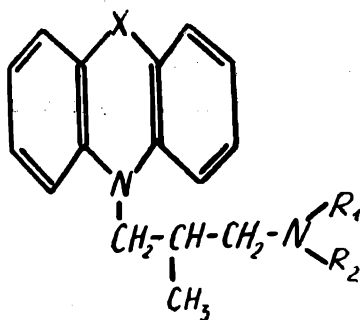
Podany niżej przykład, nie ograniczając wynalazku, obrazuje, jak sposób według wynalazku można przeprowadzić praktycznie. Wymienione w nim temperatury topnienia zostały oznaczone w bloku Koflera.

Przykład 9 g 10'-fenotiazynylokarboksylanu 2-metylo-3-dwumetyloamino-1-propylu o temperaturze topnienia $62-63^{\circ}\text{C}$ ogrzewa się do temperatury około $200-220^{\circ}\text{C}$ aż do zakończenia wydzielania się gazu (czas trwania reakcji około 50 minut). Produkt otrzymuje się destylując pod zmniejszonym ciśnieniem. Otrzymuje się 6,7 g 10-(3'-dwumetyloamino-2'-metylo-1'-propylo)-fenotiazyny o temperaturze wrzenia $168-170^{\circ}\text{C}$ pod ciśnieniem 0,1 mm Hg i o temperaturze topnienia $67-68^{\circ}\text{C}$.

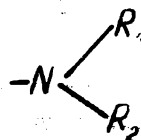
Ester wyjściowy można otrzymać przez kondensację 3-dwumetyloamino-2-metylopropanolu z chlorkiem kwasu 10-fenotiazynylokarboksylowego.

Zastrzeżenie patentowe

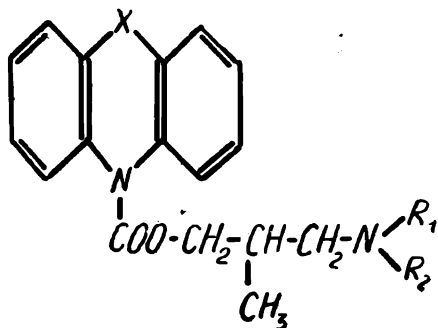
Sposób wytwarzania pochodnych fenotiazyny, według patentu nr 42846 odpowiadających ogólnemu wzorowi



w którym X oznacza atom siarki lub rodnik -SO- lub -SO₂- a R₁ i R₂, które są identyczne lub różne, oznaczają atomy wodoru lub niższe rodniki alkilowe, przy czym grupa



może również oznaczać rodnik heterocykliczny
pyrolidynowy, piperydynowy lub morfolinowy,
znamienny tym, że 10-fenotiazynylokarboksylan
aminoalkoholu o wzorze ogólnym



w którym poszczególne symbole posiadają wy-
żej podane znaczenie, ogrzewa się do tempera-
tury powyżej 100° C, najlepiej do temperatury
150—220° C, aż do ustania wydzielania się dwu-
tlenku węgla.

Société des Usines Chimiques

Rhône — Poulenc

Zastępca: inż. Józef Felkner,
rzecznik patentowy