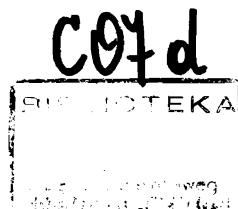


15 czerwca 1929 r.

2

URZĄD PATENTOWY



## RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ OPIS PATENTOWY

Nr 9884.

Kl. 12 p 1.

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

### Sposób otrzymywania 6 - alkoksy - 8 - aminochinolin.

Zgłoszono 22 kwietnia 1926 r.

Udzielono 18 stycznia 1929 r.

Pierwszeństwo: 29 kwietnia 1925 r. (Niemcy).

Pochodne aminowe alkoksychinolin są już znane, np. 5-amino-8-etoksychinolina (patenty niemieckie NrNr 60308, 65102, 65111), której związek *N*-acetylowy wykazuje godne uwagi własności przeciwrączkowe.

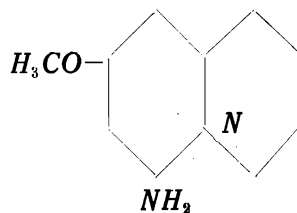
Obecnie wykryto, że nieznana dotychczas 6-alkoksy-8-aminochinolina poza wspomnianą powyżej własnością przeciwrączkową posiada zdolność niszczenia pasorzytów krwi.

Związki te otrzymuje się zapomocą redukcji 6-alkoksy-8-nitrochinolin lub 6-alkoksy-8-azo-arylochinolin według metod, stosowanych zwykle do redukowania tych ciał. Związki powyższe można również otrzymać przez alkylowanie przy tlenie

grupy hydroksylowej, np. 6-oksy-8-formylo-aminochinoliny i następnie odszczepienie reszty formylowej względnie benzalowej lub samej 6-oksy-8-aminochinoliny.

6-alkoksy-8-aminochinoliny można stosować same jako lekarstwa lub jako produkty pośrednie do otrzymywania cennych pochodnych leczniczych.

Przykład I.



5,0 kg 6-metoksy-8-nitrochinoliny rozpuszcza się w 20 l czystego, stężonego kwasu solnego i wlewa w stanie ciepłym do 60 l chlorku cynawego, zawierającego w litrze roztworu 600 g chlorku cynawego. Po godzinnej ogrzewaniu w temperaturze 100° dodaje się 100 l stężonego kwasu solnego i sól podwójną chlorocynową odsącza, przemywa kwasem solnym i rozkłada w sposób zwykły.

Otrzymana w ten sposób 6-metoksy-8-aminochinolina wrze przy 1 mm ciśnienia w temperaturze 137—138°. Jest to ciecz oleista gęsta, która krzepnie na prawie białą masę krystaliczną, mającą punkt topliwości 41°. Z kwasem solnym tworzy pięknie krystalizujący chlorowodorek o barwie pomarańczowej, trudno rozpuszczalny w wodzie zimnej. Zamiast chlorku cynawego można stosować inne środki redukcyjne, jak np. cynk lub żelazo, elektrolizę redukcyjną i t. d.

6-metoksy-8-nitrochinolinę otrzymuje się w sposób następujący:

610 g 1-amino-2-nitro-4-metoksybenzeny  
515 g sproszkowanego kwasu arsenowego

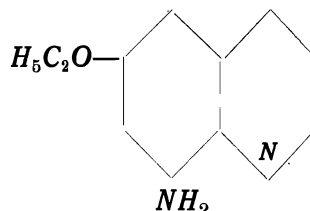
800 cm<sup>3</sup> gliceryny D = 1,255 i

550 cm<sup>3</sup> kwasu siarkowego 66° Bé

ogrzewa się na łaźni olejowej, ogrzanej do temperatury 180—190°. Skoro reakcja rozpocznie się wyraźnie, na co wskazuje wydzielanie się pęcherzyków, natenczas łaźnię olejową usuwa się. Po ustaniu burzliwej reakcji, masę reakcyjną ogrzewa się na łaźni olejowej jeszcze w ciągu 5 godzin, w temperaturze zewnętrznej 160—170°. Po ostudzeniu, mieszaninę wylewa się na 2 kg lodu i odsącza. Przesącz alkalizuje się NaOH, ochładza się nieco i odsącza surową 6-metoksy-8-nitrochinolinę, którą następnie oczyszcza się przez rozpuszczenie

w kwasie solnym, traktowaniem węglem kostnym, osadzenie zapomocą NaOH i ekstrahowanie acetonem lub przekrystalizowanie z alkoholu. Produkt otrzymany jest proszkiem krystalicznym, prawie bezbarwnym, wrzący w temperaturze 154°.

Przykład II.



188 g 6-oksy-8-formylaminochinoliny wprowadza się do roztworu zawierającego 23 g sodu w 3 l alkoholu. Następnie dodaje się 156 g jodku etylowego i ogrzewa pod chłodnicą zwrotną w ciągu 4 godzin. Utworzony jodek sodowy odsącza się i odpędza alkohol, pozostałość rozpuszcza się w eterze i przemywa kilkakrotnie ługiem sodowym i wreszcie wodą. Po odpędzeniu eteru, pozostałość rozpuszcza się w 3 l rozcieńczonego kwasu siarkowego i gotuje pod chłodnicą zwrotną w ciągu 4—6 godzin. Po zubożeniu sodą, produkt wyciąga się eterem i roztwór eterowy przemywa dokładnie ługiem sodowym i wodą, poczem po osuszeniu eter odpędza się. Otrzymana w ten sposób 6-etoksy-8-aminochinolina przechodzi pod ciśnieniem 1 mm w granicach 144 — 145°. Jest to żółta ciecz oleista, krzepnąca szybko na masę krystaliczną, topiącą się w temperaturze 60°. Chlorowodorek tego związku, pod względem barwy i rozpuszczalności, wykazuje własności podobne, jak i jego homolog niższy, opisany w przykładzie I.

## Zastrzeżenie patentowe.

Sposób otrzymywania 6-alkoksy-8-aminochinolin, znamienny tem, że 8-nitro lub 8-azopochodne 6-alkyloksychinoliny redukuje się względnie 6-oksy-8-aminochinolinę lub jej podobne alkyluje się przy tlenie grupy hydroksylowej i w razie po-

trzeby otrzymane w ten sposób *N*-pochodne 6-alkoksy-8-aminochinoliny przeprowadza się w odnośne zasady.

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