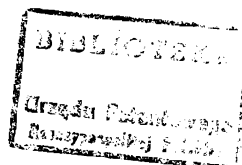


Warszawa, dnia 30 kwietnia 1953 r.



C07d 29/24



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 3530A

Kl. 12 p, 1/01

Główny Instytut Chemii Przemysłowej*)

(Warszawa, Polska)

Sposób wytwarzania środków znieczulających

Udzielono patentu z mocą od dnia 31 stycznia 1951 r.

Znany jest środek znieczulający zwłaszcza do znieczuleń naoponowych rdzenia kręgowego otrzymywany za pomocą benzoilowania produktu kondensacji α -pipekoliny z chlorohydryną glikolu propylenowego.

Stwierdzono obecnie, że podobne właściwości znieczulające wykazują również benzoilowane produkty kondensacji σ , α' -lupetydyny z chlorohydryną glikolu propylenowego lub z chlorohydryną glikolu etylenowego. Można więc przerabiać na cenne związki znieczulające 2,6-dwumetylopirydynę (α , α' -lutydynę, którą za pomocą uwodorniania przeprowadza się w α , α' -lupetydynę służącą jako materiał wyjściowy do otrzymywania nowych związków znieczulających.

Uwodornianie 2,6-lutydyny na 2,6-lupetydynę przeprowadza się w sposób znany, np. przez działanie na nią sodem metalicznym w obecności alkoholu absolutnego. Otrzymuje się przy tym mieszaninę izomeronów przestrzennych

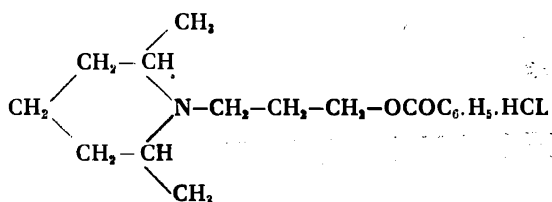
α , α' -lupetydyny i α , α' -izolupetydyny, którą bez rozdzielania na poszczególne izomery przestrzenne poddaje się kondensacji z chlorohydryną glikolu 1,3-propylenowego lub etylenowego. Otrzymuje się mieszaninę produktów kondensacji utworzoną z pochodnych wspomnianych izomeronów przestrzennych.

Sposób wytwarzania środków znieczulających według wynalazku polega na tym, że produkty kondensacji σ , α' -lupetydyny z chlorohydryną glikolu 1,3-propylenowego lub etylenowego poddaje się działaniu chlorku benzoilu.

Przykład I. 4 g produktu kondensacji 2,6-lupetydyny z chlorohydryną glikolu 1,3-propylenowego ogrzewa się z 3,28 g chlorku benzoilu i 20 cm³ benzenu w ciągu pół godziny w łaźni parafinowej, pod chłodnicą zwrotną, w temperaturze 100 — 110°C. Po odpędzeniu benzenu pozostałość zadaje się wodnym roztworem węgla sodu, a następnie kilkakrotnie wytrząsa z eterem. Wyciąg eterowy osusza się bezwodnym siarczanem sodu i wysyca bezwodnym chlorowodorem. Wytrąca się olej, który po dłuższym chłodzeniu w lodówce zestala się na bez-

*) Właściciel patentu oświadczył, że wynalazcami są Edwin Płazek i Antoni Inasiński w Warszawie.

barwną szklistą masę. Produkt wykrystalizowany z benzenu topnieje w temperaturze 149 — 156°C i kilkakrotnie nawet przekrystalizowanie nie powoduje wzrostu temperatury topnienia. Związek rozpuszcza się łatwo w wodzie i alkoholu. Otrzymywany związek posiada wzór następujący:



Analiza. Obliczono dla $\text{C}_{17}\text{H}_{25}\text{O}_2\text{N} \cdot \text{HCl}$: 65,47% C; 8,40% H; 4,49% N.

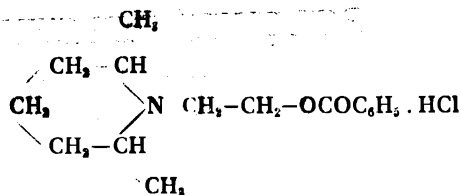
Znaleziono 65,23% C; 8,50% H; 4,64% N.

Przykład II. 2,5 g produktu kondensacji 2,6-lupetydyny z chlorohydryną glikolu etylenowego i 2,24 g chlorku benzoilu ogrzewa się w roztworze 20 cm³ benzenu, pod chłodnicą zwrotną, w łaźni parafinowej, w temperaturze 100 — 110°C. Następnie benzen odpędza się, pozostałość zadaje roztworem węgla sodu i wytrząsa kilkakrotnie z eterem. Wyciąg eterowy osusza się bezwodnym siarczanem sodu i wvysca bezwodnym chlorowodorem.

Wydziela się bezbarwny krystaliczny osad, który przekrystalizowuje się z bezwodnego ben-

zenu. W pewnych warunkach substancja wydziela się w postaci oleju, który jednak po pewnym czasie krzepnie. Kilkakrotna nawet kryształizacja z benzenu, nie prowadzi do substancji o ostrej temperaturze topnienia (mieszanina izomerów przestrzennych). Temperatura topnienia kryształów wynosi 16 — 184°C.

Związek łatwo rozpuszcza się w alkoholu i wodzie, trudno w benzenie i posiada wzór następujący:



Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania środków znieczulających, zamienny tym, że produkt kondensacji α, α' -lupetydyny z chlorohydryną glikolu 1,3-propylenowego lub z chlorohydryną glikolu etylenowego poddaje się działaniu chlorku benzoilu.

Główny Instytut Chemii
Przemysłowej

Zastępca: Kolegium Rzeczników Patentowych