



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

202336

(11)

(B1)

(22) Přihlášeno 06 10 78

(21) PV 6512-78

(40) Zveřejněno 30 04 80

(45) Vydáno 30 07 82

(51) Int. Cl.³

C 07 D 337/12

A 61 K 31/38

[75]

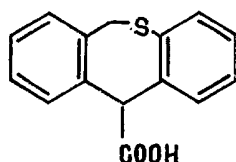
Autor vynálezu

RAJŠNER MIROSLAV, Ing., CSc. a
PROTIVA MIROSLAV, Dr., Ing., DrSc., Praha

[54] Způsob přípravy nové kyseliny 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karboxylové

1

Tento vynález se týká způsobu přípravy nové kyseliny 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karboxylové vzorce I,



(I)

Látka vzorce I je výhodným meziproduktem výroby farmakodynamicky účinných látek, zvláště léčiv ze skupin psychotropních, kardiovaskulárně aktivních a protizánětlivých látek.

Způsob přípravy kyseliny vzorce I podle tohoto vynálezu spočívá v kyselé hydrolýze známého 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karbonitrilu [V. Seidlová a spol., Monatsh. Chem. **96**, 650, **1965**], vzorce II



(II)

2

K hydrolýze zvláště vhodná je vroucí zředěná kyselina sírová o koncentraci 40 až 60 %. Nová kyselina vzorce I je krystalická látka s t. t. 216,5 až 218 °C. Vykazuje charakteristické IČ a NMR spektrum, čehož lze použít k její identifikaci.

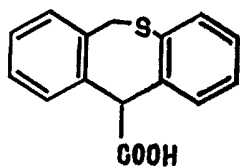
Další podrobnosti provedení přípravy látky I podle tohoto vynálezu jsou uvedeny v příkladu provedení, který je ovšem jen ilustrací možností vynálezu, aniž by bylo jeho účelem všechny tyto možnosti vyčerpávajícím způsobem popisovat.

Příklad

Směs 5,2 g 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karbonitrilu a 35 ml 55 % kyseliny sírové se vaří 5 hodin pod zpětným chladičem. Potom se zředí 100 ml vody, vodná fáze se oddělí dekantací od polopevného vyloučeného produktu, který se po promytí vodou rozpustí ve směsi 100 ml vody a 18 ml 20 % roztoku hydroxidu sodného. Vzniklý roztok sodné soli se zfiltruje s uhlím a filtrát se okyslí kyselinou solnou. Po stání do druhého dne se vyloučená kyselina 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karboxylová vzorce I odsaje, promyje vodou a vysuší ve vakuu. Získá se 3,6 g (64 %) produktu s t. t. 211 až 213 °C. Krystalizací z 90 % etanolu se získá čistá látka s t. t. 216,5 až 218 °C.

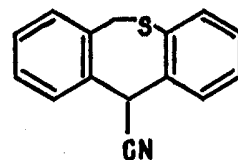
PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob přípravy nové kyseliny 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karboxylové vzorce I



(I)

vyznačuje se tím, že se 6,11-dihydrodibenzo(b, e)thiepin-11-karbonitril vzorce II



(II)

kysele hydrolizuje.

2. Způsob podle bodu 1, vyznačuje se tím, že se nitril vzorce II hydrolyzuje vroucí 40 až 60 % kyselinou sírovou.