

POLSKA  
RZECZPOSPOLITA  
LUDOWA



URZĄD  
PATENTOWY  
PRL

# OPIS PATENTOWY

53356

Patent dodatkowy nr 51 839  
do patentu

Zgłoszono: 20.IV.1965 (P 108 461)

Pierwszeństwo: \_\_\_\_\_

Opublikowano: 10.VI.1967

Kl. 12 q, 13

MKP C 07 c

UKD

83/04

Współtwórcy wynalazku: mgr Jerzy Wolf, mgr Ryszard Palanowski,  
mgr Marta Krajewska

Właściciel patentu: Instytut Farmaceutyczny, Warszawa (Polska)

## Sposób wytwarzania pochodnych 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowych

1

Przedmiotem patentu nr 51839 jest sposób wytwarzania nowych pochodnych 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowych o wzorze ogólnym 1, w którym  $R_1$  oznacza wodór, grupę alkilową lub aryłową,  $n$  oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą począwszy od 1, a  $R_2$  oznacza grupę aryłową, aryloksylową lub ich pochodne, polegający na kondensacji hydroksyloaminy lub O-pochodnych hydroksyloaminy z odpowiednimi epitlenkami.

Obecnie stwierdzono, że w podobny sposób można otrzymać analogiczne nowe związki o tym samym wzorze ogólnym 1, w którym  $n$  i  $R_1$  mają znaczenie wyżej podane, a  $R_2$  oznacza częściowo lub całkowicie uwodornioną grupę aryłową, aryloksylową lub ich pochodne, taką jak pochodne cykloheksenu, cykloheksanu, lub pierścieni heterocyklicznych, taki jak pirydynowy, piperidynowy, podstawiony lub nie podstawiony. Związki te wykazują również działanie fizjologiczne i wobec tego mogą znaleźć zastosowanie terapeutyczne.

Według wynalazku nowe pochodne 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowe wytwarza się przez kondensację hydroksyloaminy lub O-pochodnych hydroksyloaminy o wzorze 2, w którym  $R_1$  oznacza grupę alkilową lub aryłową, z epitlenkami o wzorze ogólnym 3, w którym  $n$  ma znaczenie wyżej podane, a  $R_2$  oznacza częściowo lub całkowicie uwodornioną grupę aryłową, aryloksylową i ich pochodne, lub pierścieni heterocyklicznych, z podstawnikami lub

2

bez podstawników, w sposób opisany w patencie głównym.

Reakcję kondensacji prowadzi się bez katalizatora lub w obecności katalizatora, którym mogą być nieznaczne ilości zasady nieorganicznej lub organicznej, oraz w roztworze rozpuszczalników organicznych rozpuszczających dane substraty, jak na przykład w alkoholu alifatycznym, dioksanie, czterowodorofuranie, dwumetyloformamidzie.

Szczególnie korzystne okazało się prowadzenie reakcji w temperaturze wrzenia mieszaniny reakcyjnej, w zakresie temperatur 60—180°, w zależności od rodzaju rozpuszczalnika organicznego.

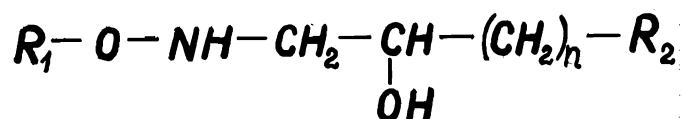
Przykład. 3 g 1,2-epoksy-3-cykloheksyloksypropanu i 1,8 g butoksyaminy w 50 ml alkoholu etylowego ogrzewano do wrzenia przez 6 godzin. Po oddestylowaniu rozpuszczalnika pozostały olej poddano destylacji próżniowej. Zbierano frakcję wrzącą w temperaturze 128—135°/0,5 mm Hg, będącą 1-butoksyamino-2-hydroksy-3-cykloheksyloksypropanem.

### Zastrzeżenie patentowe

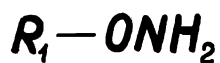
Sposób wytwarzania nowych pochodnych 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowych o wzorze ogólnym 1, w którym  $R_1$  oznacza wodór, grupę alkilową lub aryłową,  $n$  oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą począwszy od 1, a  $R_2$  oznacza częściowo lub

całkowicie uwodornioną grupę aryłową, aryloksylową i ich pochodne lub pierścień heterocykliczny, z podstawnikami lub bez podstawników, polegający na kondensacji hydroksyloaminy lub jej po-

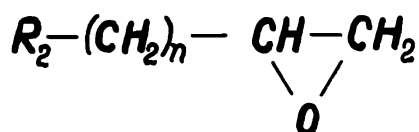
chodnej, z. epitlenkiem według patentu nr 51839, **znamienny tym**, że jako epitlenek stosuje się związek o wzorze ogólnym 3, w którym n i R<sub>2</sub> mają wyżej podane znaczenie.



**Wzór 1**



**Wzór 2**



**Wzór 3**