



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 47432

Kl. 12 p. 4
Kl. internat. C 07 d

Rhône — Poulenc S. A.

Paryż, Francja

Sposób wytwarzania nowej pochodnej fenotiazyny

Patent trwa od dnia 16 listopada 1961 r.

Pierwszeństwo: 7 grudnia 1960 r. (Francja)

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowej pochodnej fenotiazyny, 10-(2'-metanosulfonyloksy-1'-propylo)-fenotiazyny o wzorze przedstawionym na rysunku.

Według wynalazku tę nową pochodną można otrzymać przez estyfikację 10-(2'-hydroksy-1'-propylo)-fenotiazyny za pomocą pochodnej kwasu metanosulfonowego, a zwłaszcza jego chlorku lub jego bezwodnika.

Nowa pochodna wykazuje ciekawe właściwości chemoterapeutyczne, a zwłaszcza jest doskonałym środkiem przeciwrakowym. Można ją stosować przy leczeniu ludzi w dawkach zawartych ogólnie między 50—100 mg/kg na dzień, podawanych doustnie w postaci tabletek lub granulek i w dawkach między 10—25 mg/kg na dzień w zastrzykach dożylnych.

Poniżej przytoczony przykład pokazuje jak można wynalazek wykonywać w praktyce nie ograniczając jego zakresu.

Przykład: 102,8 g 10-(2'-hydroksy-1'-propylo)-

fenotiazyny rozpuszcza się w 500 cm³ bezwodnej pirydyny. Oziębia się w kąpeli suchego bezwodnika węglowego i metanolu do — 10°, po czym dodaje w trakcie mieszania, w ciągu 15 minut 91,6 g metanosulfochlorku. Następnie odstawia się na 1 godzinę w temperaturze — 5°, po czym umieszcza się na noc w lodówce, w zamkniętej kolbie.

Następnego dnia zawartość wylewa się na 1200 g miążko utłuczonego lodu. Wytrąca się produkt w postaci żywicy. Dekantuje się warstwę wodną pirydyny i przemywa żywicę 500 cm³ wody lodowatej.

Żywicę rozpuszcza się w litrze chloroformu, przemywa roztworem normalnego kwasu solnego aby usunąć alkaliczność, a następnie wodą.

Roztwór suszy się nad siarczanem sodowym i zagęszcza pod próżnią. Otrzymuje się 134 g 10-(2'-metanosulfonyloksy-1'-propylo)-fenotiazyny, która po przekrystalizowaniu w octanie etylu ma temperaturę topnienia 163—164°.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowej pochodnej fenotiazyny 10-(2'-metanosulfonyloksy-1'-propylo)-fenotiazyny, znamienny tym, że 10-(2'-hydroksy-

1'-propylo)-fenotiazynę estryfikuje się pochodną kwasu metanosulfonowego.

Rhône — Poulenc S. A.

Zastępca: inż. Józef Felkner
rzecznik patentowy