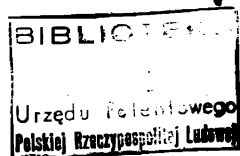


Wyd 29/20.



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ OPIS PATENTOWY

Nr 45821

Kl. 12 p, 1/01

Instytut Farmaceutyczny *)

Warszawa, Polska

Sposób wytwarzania pochodnych 2,6-dwuketo-3-aminopiperydyny

Patent trwa od dnia 10 października 1960 r.

Wynalazek dotyczy wytwarzania pochodnych 2, 6 - dwuketo - 3 - aminopiperydyny o wzorze 1, w którym R₁ i R₂ oznaczają wodór lub dowolne podstawniki, a zwłaszcza 2,6 - dwuketo - 3 - ftalimidopiperydyny o wzorze 2. Związki te otrzymuje się według literatury patentowej przez kondensację alifatycznych dwukarboksylowych kwasów lub ich bezwodników z mocznikiem, aminami pierwszorzędowymi lub amidami kwasowymi, przy czym powstają cykliczne produkty. Sposoby te są dość trudne do przeprowadzenia i nie mają znaczenia technologicznego. Według opisu patentowego Stanów Zjednoczonych Ameryki nr 2, 830,991 oraz brytyjskiego opisu patentowego nr 768,821 3-ftalimido-2,6-dwuketopiperydynę otrzymuje się przez przepuszczenie gazowego amoniaku przez stopiony bezwodnik kwasu N-ftaliloglutaminowego. Sposób ten posiada tę wadę, że trudno uzyskać

równomierny przepływ amoniaku przez stop, który nie jest dostatecznie płynny i krzepnie u wylotu rury doprowadzającej amoniak, na skutek czego wydajność reakcji jest zbyt mała.

Sposób według wynalazku polega na stwierdzeniu, że odpowiednio podstawiona glutamina przy ogrzewaniu do temperatury 150—250°C przechodzi w pożądaną związek cykliczny, przy czym stosowanie jakichkolwiek dodatków jest zbędne, reakcja przebiega z wydajnością powyżej 50% i nie wymaga żadnych skomplikowanych urządzeń. N-pochodne glutaminy są stosowane do różnych innych organicznych syntez i stanowią związki łatwo dostępne.

Przykład. 27,6 g N-ftaliloglutaminy ogrzewano w tyglu na łożni piaskowej, przy czym okres ogrzewania od temperatury 160—210°C trwał 5 minut. Po oziębieniu produkt przekrystalizowano z cykloheksanonu, otrzymu-

*) Właściciel patentu oświadczył, że twórcą wynalazku jest mgr inż. Stefan Sabiniewicz.

jąc 3-ftalimido-2,6-dwuketopiperydynę w ilości 14,2 g, co odpowiada 55,21% wydajności teoretycznej.

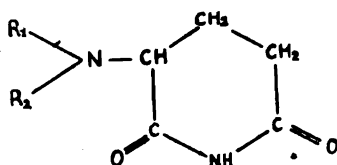
Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania pochodnych 2,6-dwuketo-3-aminopiperydyny, a w szczególności 2,6-dwuketo-3-ftalimidopiperydyny, znamienny

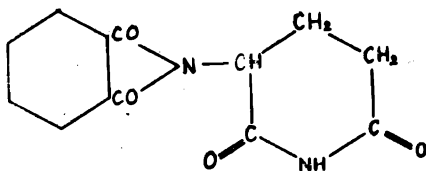
tym, że odpowiednio podstawioną glutaminę ogrzewa się w ciągu kilku minut w granicach temperatur 150—250°C po czym produkt reakcji poddaje się rekrystalizacji.

Instytut Farmaceutyczny

Zastępca mgr inż. Witold Hennel
rzecznik patentowy



Wzór 1



Wzór 2