



Patent dodatkowy
do patentu nr 51 840

Zgłoszono: 20.IV.1965 (P 108 462)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 20.VII.1967

Kl. 12 q, 13

MKP C 07 c

131/04

UKD

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

Właściciel patentu: Instytut Farmaceutyczny, Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania nowych O-podstawionych pochodnych oksymów

1

Przedmiotem patentu nr 51840 jest sposób wytwarzania nowych O-podstawionych oksymów o wzorze ogólnym 1, w którym R_1 i R_2 mogą być jednakowe lub różne i oznaczają wodór, grupę alkilową lub arylową, n oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą począwszy od 1, a R_3 oznacza grupę arylową, arylooksyłową lub ich pochodne.

Stwierdzono, że w podobny sposób można otrzymać analogiczne nowe związki o tym samym wzorze ogólnym 1, w którym R_1 i R_2 mogą być jednakowe lub różne i oznaczają wodór, grupę alkilową lub arylową, lub tworzą łącznie pierścień aromatyczny częściowo lub całkowicie uwodorniony, podstawiony lub nie podstawiony, n ma znaczenie wyżej podane, a R_3 oznacza częściowo lub całkowicie uwodornioną grupę arylową, arylooksyłową i ich pochodne, jak pochodne cykloheksenu, cykloheksanu lub pierścień heterocykliczny, taki jak pirydynowy, piperidynowy, podstawiony lub niepodstawiony. Związki te wykazują również działanie fizjologiczne i wobec tego mogą znaleźć zastosowanie terapeutyczne.

Według wynalazku nowe O-podstawione pochodne oksymów wytwarza się przez kondensację pochodnych oksymów o wzorze ogólnym 2, w którym R_1 i R_2 mogą być jednakowe lub różne i oznaczają wodór, grupę alkilową lub arylową, lub tworzą łącznie pierścień aromatyczny częściowo lub całkowicie uwodorniony, podstawiony lub nie

2

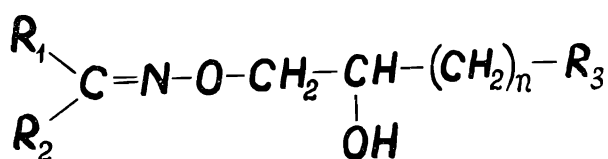
podstawiony, z epitlenkami o wzorze ogólnym 3, w którym n ma podane znaczenie, a R_3 oznacza częściowo lub całkowicie uwodornioną grupę aryłową, arylooksyłową i ich pochodne lub pierścień heterocykliczny, podstawiony lub nie podstawiony.

Reakcję prowadzi się bez katalizatora lub w obecności katalizatora, którym mogą być nieznaczne ilości zasady nieorganicznej lub organicznej, takiej jak wodorotlenek metalu alkalicznego, piperydyna, trójetyleamina, oraz w środowisku rozpuszczalników organicznych rozpuszczających dane substraty, takich jak alkohol alifatyczny, dioksan, dwumetyloformamid lub czterowodorofuran. Kondensację prowadzi się w podwyższonej temperaturze, korzystnie w temperaturze wrzenia mieszaniny reakcyjnej. Produkt kondensacji wydziela się i oczyszcza w znany sposób.

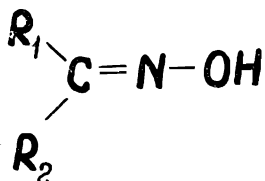
Przykład. 3 g 1,2-epoksy-3-cykloheksylooksypropanu, 2 g oksymu cykloheksanonu i 0,5 ml trójetyleaminy w 25 ml alkoholu etylowego ogrzewano do wrzenia przez 2,5 godziny, oddestylowano rozpuszczalnik, a pozostały olej poddano destylacji próżniowej. Zbierano frakcję wrzącą w temperaturze 150—155°/0,1 mm Hg będącą O-eterem 2-hydroksy-3-cykloheksylooksy-propylowym oksymu cykloheksanonu.

Sposób wytwarzania nowych O-podstawionych pochodnych oksymów o wzorze ogólnym 1, w którym R_1 i R_2 mogą być jednakowe lub różne i oznaczają wodór, grupę alkilową lub arylową, lub tworzą łącznie pierścień aromatyczny częściowo lub całkowicie uwodorniony, podstawiony lub nie podstawiony, n oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą począwszy od 1, a R_3 oznacza częściowo

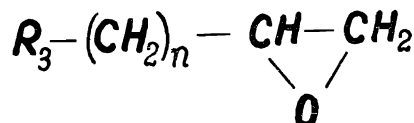
lub całkowicie uwodornioną grupę arylową, aryloksylową i ich pochodne lub pierścień heterocykliczny, podstawiony lub nie podstawiony, polegający na kondensacji pochodnych oksymu z epitlenkami według patentu nr 51 840, **znamienny tym**, że pochodne oksymu o wzorze ogólnym 2, w którym R_1 i R_2 mają podane wyżej znaczenie, kondensuje się z epitlenkami o wzorze ogólnym 3, w którym n i R_3 mają wyżej podane znaczenie.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3