

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY

66776

Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 13.IV.1968 (P 148 624)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 20.XII.1972

Kl. 12p,3

MKP C07d 85/26

UKD

Współtwórcy wynalazku: Czesław Bełzecki, Stanisław Pęksa

Właściciel patentu: Polska Akademia Nauk (Instytut Chemii Organicznej), Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania nowych pochodnych 5-fenylo-2-imino-oksazolidyny

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych 5-fenylo-2-imino-oksazolidyny o ogólnym wzorze 1, w którym podstawniki R są jednakowe lub różne i oznaczają wodór lub rodnik fenyłowy. Związki wytwarzane według wynalazku są farmakologicznie czynne i wykazują działanie uwalniania katecholamin oraz blokujące zakończenia adrenergiczne.

Stwierdzono, że nowe związki otrzymuje się, jeżeli tlenek styrenu poddaje się reakcji z fenyłową pochodną guanidyny o wzorze ogólnym 2, w którym podstawniki R mają takie same znaczenie jak we wzorze 1, a produkt reakcji wyodrębnia się w znany sposób.

Reakcję według wynalazku prowadzi się w rozpuszczalniku organicznym, w podwyższonej temperaturze. Mechanizm reakcji polega na tym, że następuje otwarcie pierścienia oksiranowego tlenku styrenu i przyłączenie fenyłowej pochodnej guanidyny z utworzeniem odpowiedniej β -fenylo- β -hydroksyetyloguanidyny, która pod wpływem ogrzewania cyklizuje samorzutnie z wydzieleniem cząsteczki aminy bądź amoniaku dając w rezultacie odpowiedni układ 5-fenylo-2-imino-oksazolidyny.

Sposób według wynalazku jest prosty do przeprowadzenia z wysoką wydajnością, a stosowane w nim substraty są łatwo dostępne.

Poniższe przykłady bliżej charakteryzują sposób według wynalazku nie ograniczając jego zakresu.

Przykład I. 12,0 g (0,1 mola) tlenku styrenu i 0,1 mola N-fenyloguanidyny rozpuszczono w 150 ml absolutnego etanolu i ogrzewano pod chłodnicą zwrotną

2

w ciągu 5 godzin podczas mieszania stosując jednocześnie zabezpieczenie przed wilgocią i CO_2 z powietrza. Po zakończeniu ogrzewania rozpuszczalnik odparowuje się pod zmniejszonym ciśnieniem, a pozostałość rozpuszcza się w rozcieńczonym HCl i kilkakrotnie ekstrahuje eterem. Wodny roztwór alkalizuje się nadmiarem 50% NaOH i ponownie kilkakrotnie ekstrahuje eterem. Ekstrakt organiczny suszy się nad bezwodnym MgSO_4 , po czym odparowuje rozpuszczalnik, a pozostałość krystalizuje z 96% etanolu lub CCl_4 . Otrzymano 2-fenyloimino-5-fenylooksazolidynę o temperaturze topnienia 130°C z wydajności 78%.

Analiza elementarna dla wzoru sumarycznego $\text{C}_{21}\text{H}_{18}\text{ON}_2$

obliczono	C 80,23%	H 5,77%	N 8,91%
znaleziono	C 80,88%	H 5,74%	N 8,90%

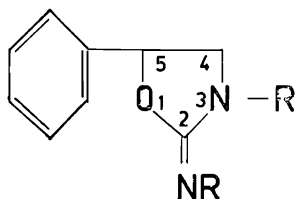
Postępując analogicznie jak w przykładzie I otrzymuje się 2-fenyloimino-3,5-dwufenylooksazolidynę o temperaturze topnienia 118°C , stosując zamiast N-fenyloguanidyny N,N'-dwufenyloguanidynę bądź N,N,N''-trójfenyloguanidynę lub N,N,N,N''-czterofenyloguanidynę.

Zastrzeżenia patentowe

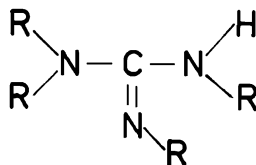
1. Sposób wytwarzania nowych pochodnych 5-fenylo-2-imino-oksazolidyny o ogólnym wzorze 1, w którym podstawniki R są jednakowe lub różne i oznaczają wodór lub rodnik fenyłowy, **znamienny tym**, że tlenek styrenu poddaje się reakcji z fenyłową pochodną gua-

nidyny o wzorze ogólnym 2, w którym podstawniki R mają takie same znaczenie jak we wzorze 1, a produkt reakcji wyodrębnia się w znany sposób.

2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że reakcję prowadzi się w środowisku rozpuszczalnika organicznego.



wzór 1



wzór 2