



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY  
A OBJEVY

# POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

206497

(11)

(B1)

(22) Prihlášené 22 12 79

(21) (PV 9284-79)

(40) Zverejnené 29 08 80

(45) Vydané 02 05 84

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 D 405/06

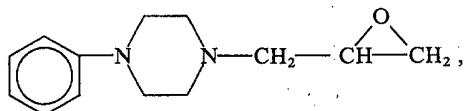
(75)

Autor vynálezu

JENDRICHOVSKÝ JÁN ing., HLOHOVEC,  
RYBÁR ALFONZ ing. CSC., BRATISLAVA,  
DÁVID LADISLAV ing., HLOHOVEC  
a FRIMM RICHARD doc. ing. CSC., BRATISLAVA

## (54) Spôsob prípravy 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazínu

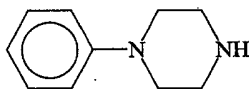
Predmetom vynálezu je spôsob prípravy dosiaľ nepopísaného 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazínu vzorca I



(I)

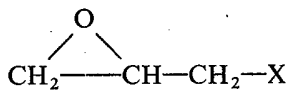
ktorý je medziproduktom pre prípravu farmakologicky účinných látok.

Podstata vynálezu spočíva v tom, že kondenzáciou 1-fenylpiperazínu vzorca II



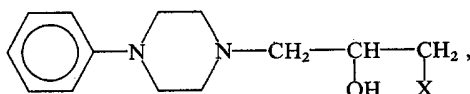
(II)

v teplotnom rozmedzí 10 až 60 °C s epihalogenhydrínom obecného vzorca III



(III)

kde X znamená chlór alebo bróm, vznikne bázičky substituovaný halogénhydrín obecného vzorca IV.



(IV)

kde X predstavuje chlór alebo bróm, ktorý sa pôsobením anorganických resp. organických báz, napr. etano-

lickým KOH, alkoholátmi alkalických kovov apod., dehydrohalogenuje na konečný 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazín uvedeného vzorca I.

V ďalšom je predmet vynálezu objasnený v príkladoch bez toho, aby sa na tieto výlučne obmedzoval.

#### Príklad 1

##### 1-(3-chlór-2-hydroxypropyl)-4-fenylpiperazín

K 1,62 kg (10 mol) fenylpiperazínu v 5 l etanolu sa za chladenia na 20 °C za miešania prikvapá 0,95 kg (10,3 molu) epichlorhydrínu. Zmes sa mieša pri 20 °C, dokiaľ nezačne kryštalizovať. Za miešania sa ochladí na 5 °C, prefiltruje, premyje etanolom (0 °C) a vysuší vákuovo pri 80 °C. Získa sa halogenhydrín vzorca IV v množstve 1,83 kg (72 %) s t.t. 104 až 107 °C.

Pre  $C_{13}H_{19}ClN_2O$  (M.h. 254,76)

% C vyp. = 61,29, % C stan. = 61,42, % H vyp. = 7,51, % H stan. = 7,73, % N vyp. = 10,99, % N stan. = 11,05, % Cl vyp. = 13,91, % Cl stan. = 13,80.

#### Príklad 2

##### 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazín

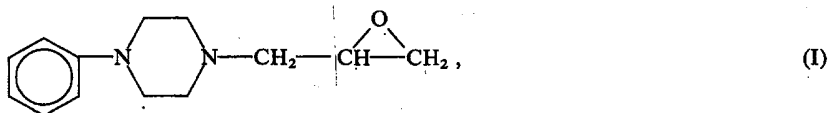
Zmes 254,8 g (1 mol) halogenhydrínu vzorca IV v 300 ml toluénu sa intenzívne mieša s roztokom 200 g hydroxidu sodného v 300 ml vody do rozpustenia halogenhydrínu (0,5 až 2 h). Toluénová vrstva sa oddelí, vodná vytrepe 2 × 200 ml toluénu. Spojené toluénové vrstvy sa vytrepávajú vodou do neutrálnej reakcie. Toluénový roztok sa zahustí vákuovo a predestiluje z filmu pri 120 °C a 2 Pa. Získa sa 170 g (78 %) epoxidu vzorca I.

Pre  $C_{13}H_{18}N_2O$  (M.h. 218,32)

% C vyp. = 71,52, % C stan. = 71,35, % H vyp. = 8,31, % H stan. = 8,27, % N vyp. = 12,83, % N stan. = 12,58.

### PREDMET VYNÁLEZU

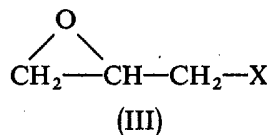
Spôsob prípravy 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazínu vzorca I



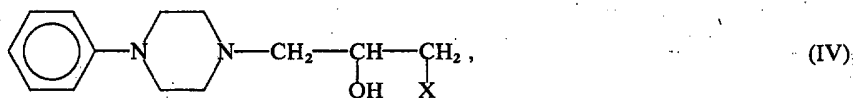
vyznačujúci sa tým, že sa kondenzuje 1-fenylpiperazín vzorca II



v teplotnom rozmedzí 10 až 60 °C s epihalogenhydrínom obecného vzorca III



kde X predstavuje chlór alebo bróm a vzniknutý 1-(3-chlór-2-hydroxypropyl)-4-fenylpiperazín obecného vzorca IV



kde X predstavuje chlór alebo bróm, sa dehydrohalogenuje na konečný 1-(2,3-epoxypropyl)-4-fenylpiperazín vzorca I anorganickými, prípadne organickými zásadami.