

2

Warszawa, dnia 2 kwietnia 1952 r.



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 34789

Kl. 12 q, 24

Spofa, Spojené farmaceutické závody, národní podnik
(Praga, Czechosłowacja)

Sposób wytwarzania estrów kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)- octowego

Udzielono z mocą od dnia 16 sierpnia 1949 r.

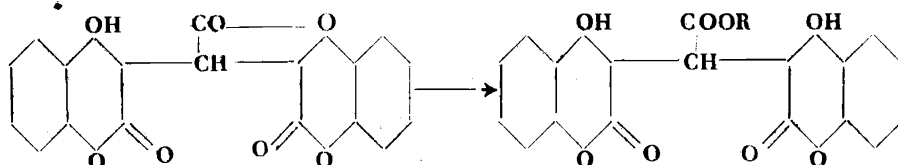
Pierwszeństwo: 30 grudnia 1948 r. (Czechosłowacja)

Jest rzeczą znaną, że niektóre pochodne, np. estry kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego są interesujące pod względem biologicznym, gdyż wykazują działanie antykoagulacyjne.

Stwierdzono, że estry tego kwasu można korzystnie wytwarzać z laktonów kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego, otrzymywanych według patentu nr 34773 i wchodzących łatwo w reakcję z substancjami zawierającymi jedną lub większą liczbę grup wodorotlenowych. W ten sposób otrzymuje się estry kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego jak np.:

Ester	Temperatura topnienia
metylowy	203 — 206° C
etylowy	176° C
propylowy	143 — 144° C
n-butyłowy	154 — 155° C
n-heksylowy	121 — 122° C
n-heptyłowy	124 — 125° C
n-oktyłowy	108 — 109° C
glikolowy	122 — 127° C
propylenoglikolowy	183° C
benzylowy	185 — 186° C
chloroetyłowy	194° C

Przy reakcji, przebiegającej wg podanego schematu, nie tworzą się jako produkty uboczne epitenki estrów.



Przykład I. 36,2 g laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego gotuje się pod chłodnicą zwrotną w 150 cm³ absolutnego etanolu (skażonego benzenem). Powstającą postać estru o niskiej temperaturze topnienia przeprowadza się przez dalsze ogrzewanie w postać o wyższej temperaturze topnienia 176° C.

Przykład II. 36,2 g laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego gotuje się w 150 cm³ alkoholu izobutyłowego. Po czterech godzinach wszystko przechodzi do roztworu, po czym roztwór zagęszcza się do potowy i wydzielony ester izobutyłowy odsącza się. Topnieje on w temperaturze 174° C.

Przykład III. 36,2 g laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego ogrzewa się do wrzenia w ciągu ok. 20 minut z 60 cm³ alkoholu benzyłowego. Po oziębieniu wykrystalizowuje ester

benzyłowy kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego o temperaturze topnienia 185° — 186° C.

Przykład IV. 36,2 g laktonu kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego ogrzewa się w ciągu czterech godzin z etylenochlorohydryną i bezbarwny roztwór zagęszcza się do krystalizacji. Otrzymany ester chloroetyłowy kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego topnieje w temperaturze 194° C.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania estrów kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego, znamienny tym, że lakton kwasu bis-(4-hydroksykumarynylo)-octowego poddaje się reakcji z substancjami zawierającymi jedną lub większą liczbę grup wodorotlenowych.

Spofa, Spojené farmaceutické závody, národní podnik

Zastępca: Kolegium Rzeczników Patentowych