



Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 13.VII.1964 (P 105 175)

Pierwszeństwo: _____

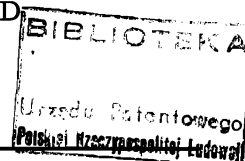
Opublikowano: 24.IX.1966

Kl. 12 q, 13

MKP C 07 c

83/04

UKD



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

Właściciel patentu: Instytut Farmaceutyczny, Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania nowych pochodnych 1-oksyamino- -2-hydroksyalkilowych

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowych o wzorze ogólnym 1, w którym R_1 oznacza wodór, grupę alkilową lub arylową, n oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą począwszy od 1, a R_2 oznacza grupę arylową, aryloksyloową lub ich pochodne.

Główna cecha charakterystyczna budowy tych związków polega na tym, że mają one przy jednym węglu w łańcuchu grupę oksyaminową, a przy sąsiednim grupę hydroksyloową. Związki te dotychczas nie opisane wykazują działanie fizjologiczne.

Sposobem według wynalazku wyżej wymienione związki wytwarza się przez kondensację związków o wzorze ogólnym 2, w którym R_1 ma wyżej podane znaczenie z epitenkami o wzorze ogólnym 3, w którym R_2 i n mają wyżej podane znaczenie.

Reakcję kondensacji prowadzi się w obecności katalitycznych ilości zasady nieorganicznej lub organicznej takiej jak np. wodorotlenek sodu lub potasu, trójetiloaminy, piperydyna lub też bez katalizatorów, w środowisku rozpuszczalników organicznych rozpuszczających dane substraty jak np. alkoholu alifatycznego, dioksanu, tetrahydrofuranu, korzystnie w temperaturze wrzenia rozpuszczalnika organicznego.

Otrzymany produkt kondensacji wydziela się po oddestylowaniu rozpuszczalnika stanowiącego środowisko reakcji i ewentualnie oczyszcza na drodze

2

destylacji lub krystalizacji z rozpuszczalników organicznych np. benzenu.

Przykład I. 3,0 g 1,2-epoksy-3-fenoksypropanu i 1,5 g propoksyaminy w 25 ml alkoholu etylowego z dodatkiem 0,1 ml trójetiloaminy ogrzewano w ciągu 8 godzin do wrzenia. Po oddestylowaniu rozpuszczalnika pozostałość oczyszczono przez destylację próżniową. Czysty 1-propoksyamino-2-hydroksy-3-fenoksypropan zbierano jako frakcję wrzącą w temperaturze 130—135° przy ciśnieniu 1,5 mm Hg.

Przykład II. 7,5 g 1,2-epoksy-3-fenoksypropanu i 1,7 g hydroksyloaminy w 40 ml alkoholu etylowego ogrzewano do wrzenia w ciągu 8 godzin. Po oddestylowaniu rozpuszczalnika pozostałość wykrystalizowano z benzenem. Otrzymano 1-oksyamino-2-hydroksy-3-fenoksypropan o temperaturze topnienia 111—113°.

Przykład III. 8,2 g 1,2-epoksy-3-p-metylofenoksypropanu i 1,7 g hydroksyloaminy w 50 ml dioksanu z dodatkiem 0,5 ml piperydyny ogrzewano w ciągu 8 godzin do wrzenia. Po oddestylowaniu rozpuszczalnika pozostałość wykrystalizowano z benzenem. Otrzymano 1-oksyamino-2-hydroksy-3-p-metylofenoksypropan o temperaturze topnienia 116—119°.

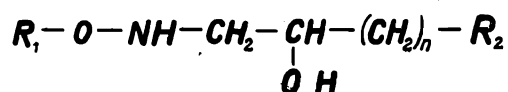
Przykład IV. 1,8 g 1,2-epoksy-3-p-metoksyfenoksypropanu i 0,4 g hydroksyloaminy w 15 ml tetrahydrofuranu ogrzewano w ciągu 8 godzin do

wrzenia. Po oddestylowaniu rozpuszczalnika pozostałość wykrystalizowano z mieszaniny benzen-eter naftowy. Otrzymano 1-oksyamino-2-hydroksy-3-p-metoksy-fenoksypropan o temperaturze topnienia 93—95°.

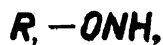
Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania nowych pochodnych 1-oksyamino-2-hydroksyalkilowych o wzorze ogólnym 1, w którym R_1 oznacza wodór, grupę alkilową lub aryłową, n oznacza zero lub dowolną liczbę całkowitą od 1, a R_2 oznacza grupę aryłową, oksyaryłową lub ich pochodne, **znamienny tym**, że związki o wzorze ogólnym 2, w którym R_1 ma wy-

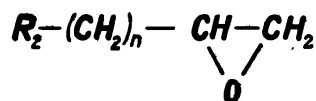
żej podane znaczenie kondensuje się z epitlenkami o wzorze ogólnym 3, w którym R_2 i n mają wyżej podane znaczenie, w środowisku rozpuszczalników organicznych takich jak alkohol alifatyczny, dioksan lub tetrahydrofuran, ewentualnie w obecności katalitycznych ilości zasady nieorganicznej lub organicznej, takiej jak wodorotlenek sodu lub potasu, piperydyna lub trójetyloamina, korzystnie w temperaturze wrzenia rozpuszczalnika organicznego po czym otrzymany produkt reakcji wydziela się po oddestylowaniu rozpuszczalnika i ewentualnie oczyszcza na drodze destylacji lub krystalizacji z rozpuszczalników organicznych takich jak np. benzen.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3