



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

209055
(11) (B1)

(51) Int. Cl.³
C 07 C 119/00

(22) Přihlášeno 21 04 80

(21) (PV 2786-80)

(40) Zveřejněno 30 01 81

(45) Vydáno 01 07 83

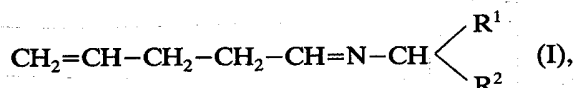
(75)

Autor vynálezu

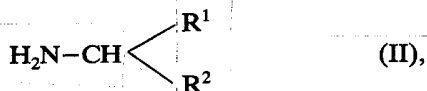
HÁJÍČEK JOSEF ing. CSc., BORO VANY a
TROJÁNEK JAN dr. ing. CSc., PRAHA

(54) Způsob výroby iminů 4-pentenalů

Synthesa iminů 4-pentenalů obecného vzorce I

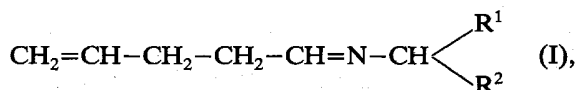


kde R^1 a R^2 tvoří dohromady pentamethylenový nebo tetramethylenový řetězec, nebo R^1 i R^2 jsou alkyly s 1 až 2 atomy uhlíku, spočívající v tom, že se 4-pentenal kondensuje s primárními aminy vzorce II



kde R^1 i R^2 mají stejný význam, za teplot -10 až $+10$ °C, výhodně při 0 °C, přičemž po ukončení reakce se přidá činidlo odnímající vodu, např. hydroxid sodný nebo draselný, nebo uhličitán draselný.

Vynález se týká způsobu výroby iminů 4-pentenalů obecného vzorce I



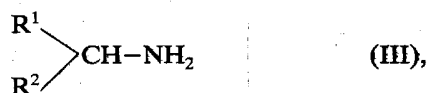
ve kterém R^1 a R^2 dohromady značí pentamethylenový nebo tetramethylenový řetězec, nebo R^1 i R^2 značí alkyl s 1 až 2 atomy uhlíku.

Sloučeniny obecného vzorce I jsou vesměs nové a jsou meziprodukty výroby farmakologicky účinných látek.

Podstata způsobu výroby podle vynálezu spočívá v tom, že se 4-pentenal vzorce II



kondensuje výhodně se stechiometrickým množstvím primárního aminu obecného vzorce III

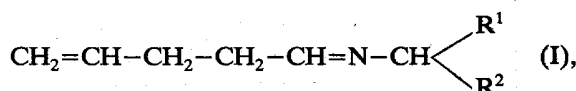


ve kterém R^1 a R^2 dohromady značí pentamethylenový nebo tetramethylenový řetězec, nebo R^1 i R^2 značí alkyl s 1 až 2 atomy uhlíku, za teplot -10 až $+10$ °C, s výhodou při teplotě 0 °C!

Po ukončení reakce se ke směsi přidá činidlo odnímající vodu, výhodně hydroxid alkalických kovů, jako je hydroxid sodný nebo draselný, nebo uhličitán alkalických kovů, např. uhličitán draselný.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Způsob výroby iminů 4-pentenalů obecného vzorce I



ve kterém R^1 a R^2 dohromady značí pentamethylenový nebo tetramethylenový řetězec, nebo R^1 i R^2 značí alkyl s 1 až 2 atomy uhlíku, vyznačující se tím, že se 4-pentenal vzorce II



Následující příklady ilustrují, avšak nikterak neomezuji obecnost způsobu podle vynálezu.

Příklady provedení

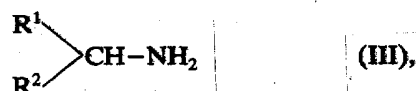
Příklad 1

K 84,3 g (0,85 mol) cyklohexylaminu (III: $\text{R}^1 + \text{R}^2 = \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$) se za míchání v rozmezí teplot -10 až 0 °C přikape 71,5 g (0,85 mol) 4-pentenalů (II) během 1,5 h. Reakční směs se ponechá stát při 0 °C 20 minut. Potom se přidá cca 10 g drceného hydroxidu sodného a směs se během 15 minut občas promíchá. Organická fáze se oddělí a suší přes noc v lednici nad drceným hydroxidem draselným. Kapalný podíl se oddělí a destiluje se ve vakuu vodní vývěvy. Získá se 104,7 g N-(4-pentenyliden)-cyklohexylaminu (I: $\text{R}^1 + \text{R}^2 = \text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$) s teplotou varu v rozmezí 87 až $88,5$ °C při tlaku 1100 Pa. Výtěžek odpovídá 74,5 % teorie.

Příklad 2

K 11,8 g (0,2 mol) 2-propylaminu (III: $\text{R}^1 = \text{R}^2 = \text{CH}_3$) se přikape za míchání 16,8 g (0,2 mol) 4-pentenalů (II) během 1 h při teplotě 0 °C. Reakční směs se ponechá stát 15 minut při téže teplotě a přidá se drcený hydroxid draselný. Po 0,5 h stání se organická fáze odlije a ponechá stát přes noc v lednici nad uhličitánem draselným. Po odfiltrování sušidla se produkt předestiluje. Získá se 16,0 g (63,8 %) N-(4-pentenyliden)-2-propylaminu (I: $\text{R}^1 = \text{R}^2 = \text{CH}_3$). Teplota varu látky leží v rozmezí 131 až 135 °C.

kondensuje výhodně se stechiometrickým množstvím primárního aminu obecného vzorce III



ve kterém R^1 i R^2 mají výše uvedený význam, při teplotě -10 až $+10$ °C, výhodně při 0 °C, přičemž při ukončení reakce se přidá činidlo odnímající vodu, s výhodou hydroxid sodný nebo draselný nebo uhličitán draselný.