



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY  
A OBJEVY

# POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

227998

(11) (B1)

(22) Přihlášeno 22 10 82  
(21) (PV 7495-82)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 C 91/32  
C 07 C 87/28

(40) Zveřejněno 15 09 83

(45) Vydáno 15 04 86

(75)  
Autor vynálezu

BUDNÍK JOSEF R<sup>u</sup>.Dr., PRAHA

## (54) Způsob přípravy hydrochloridu 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylaminu

Hydrochlorid 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylaminu se používá ve farmacii jako protišokový preparát v injekční formě.

Syntetických postupů k přípravě této látky je řada, ale dva jsou ekonomicky i technologicky nejspokladnější. První je postup podle amerického patentového spisu č. 2 749 275 z r. 1956 a druhý čs. AO č. 224 123 čs. autora. Oba dva postupy vycházejí z homoveratrylamínu, který se štěpí azeotropickou kyselinou bromovodíkovou na 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrobromid. Oba postupy se pak liší způsobem izolace 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrochloridu.

Nevýhoda obou postupů, tj. podle amerického patentového spisu č. 2 749 275 a čs. AO č. 224 123 spočívá v tom, že jsou vícestupňové, tedy výtěžkově i pracností náročné.

Postup podle amerického patentového spisu č. 2 749 275 spočívá v těchto syntetických stupních: homoveratrylamin je surovinou, homoveratrylamin hydrochlorid, 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrobromid, trojnásobná krystalizace této látky z koncentrované kyseliny chlorovodíkové za vzniku 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrochloridu. Tento postup je pětistupňový.

Podle čs. AO č. 224 123 obsahuje postup následující stupně: homoveratrylamin je surovinou, homoveratrylamin hydrochlorid, 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrobromid, převedení na bázi a vyloučení surového hydrochloridu, krystalizace surové látky. Tento postup je čtyřstupňový.

Nevýhody těchto vícestupňových syntéz odstraňuje postup podle vynálezu, který spočívá

v tom, že se homoveratrylamin hydrochlorid podrobí 150- až 200hodinovému štěpení azeotropickou kyselinou chlorovodíkovou při teplotě 80 až 110 °C. Po této době se roztok ochladí a surový 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrochlorid se vyloučí v krystalické formě. Překrystalizováním této látky se získá žádaná substance použitelná pro farmaceutické účely. Surová látka tímto postupem připravená vzniká ve výtěžku 90 až 95 % teorie.

Následující příklad provedení uvedený způsob podle vynálezu pouze dokládá, ale nijak neomezuje.

#### Příklad provedení

100 g homoveratrylaminu hydrochloridu se zahřívá za občasného zamíchání při teplotě 95 až 100 °C v roztoku 750 ml koncentrované kyselině chlorovodíkové a 250 ml vody po dobu 150 hodin. Po této době se reakční roztok ochladí a vyloučené krystaly surového 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrochloridu se odsají a na filtru promyjí acetonem. Výtěžek surové látky je 80 g, tj. 91,8 teorie. Po krystalizaci ve zředěné kyselině chlorovodíkové se získá vyhovující substance pro farmaceutické použití.

#### P R Ě D M Ě T V Y N Ā L E Z U

Způsob přípravy 2-(3,4-dihydroxyfenyl)-etylamin hydrochloridu vyznačený tím, že se homoveratrylamin hydrochlorid ponechá reagovat s azeotropickou kyselinou chlorovodíkovou po dobu 150 až 200 hodin při teplotě 80 až 110 °C.