



Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszone: 23. II. 1963 (P 100 831)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 25. V. 1964

Kl. 12 o 25

MKP *C 07 d. 107/2*
C 07 d.

UKD

Współtwórcy wynalazku: Barbara Serafinowa, Tadeusz Urbański
Właściciel patentu: Starogradzkie Zakłady Farmaceutyczne „Polfa”
Przedsiębiorstwo Państwowe, Starogard Gdański
(Polska)

Urzedu Patentowego
Polskiej Rzeczypospolitej Ludowej

Sposób wytwarzania nowych organicznych pochodnych boru

1

Stwierdzono, że można otrzymać dotychczas nieopisane w literaturze pochodne 5-nitro-1,3-dioksa-2-boracykloheksanu o ogólnym wzorze 1, w którym Z oznacza podstawnik alifatyczny, aryłowy lub heterocykliczny, zaś R_1 , R_2 , R_3 , R_4 i R_5 — oznaczają dowolny podstawnik np. alkil wolny lub podstawiony, grupę hydroksylową, aminową, chlorowec itp., które wykazują działanie biologiczne (hamują wzrost drobnoustrojów chorobotwórczych) oraz działają hamująco na centralny układ nerwowy, jeżeli podda się kondensacji kwas alkilo-, aryloborowy lub kwas borowy podstawiony grupą heterocykliczną o ogólnym wzorze $Z-B(OH)_2$ albo bezwodniki tych kwasów z podstawionymi 2-nitropropandiolami-1,3 o ogólnym wzorze 2, w którym R_1 , R_2 , R_3 , R_4 i R_5 mają znaczenie jak podano wyżej. Proces można prowadzić przy molowym stosunku substratów ewentualnie stosując nadmiar jednego z nich w rozpuszczalnikach organicznych, jak benzen, aceton i innych polarnych lub niepolarnych, w wodzie lub nawet bez rozpuszczalnika. Reakcja przebiega w temperaturze wrzenia rozpuszczalnika w granicach 30—180°C w ciągu kilkunastu minut do kilku godzin. Otrzymany produkt oczyszcza się przez destylację, zwłaszcza próżniową lub przez krystalizację.

Przykład. 12 g kwasu fenyloborowego i 15 g 2-nitro-2-etylo-propandiolu-1,3 ogrzewa się do wrzenia w 50 ml acetonu w ciągu 15 minut. Po zakoń-

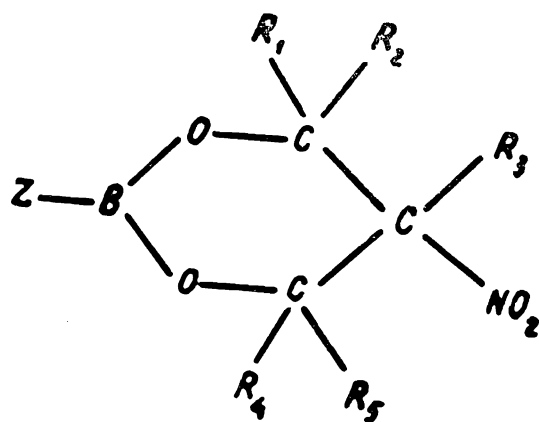
2

czeniu reakcji oddestylowuje się rozpuszczalnik a produkt przekrystalizowuje z metanolu. Otrzymuje się 21 g (90% teorii) 2-fenilo-5-nitro-5-etylo-1,3-dioksa-2-boracykloheksanu o temperaturze topnienia 129—131°C.

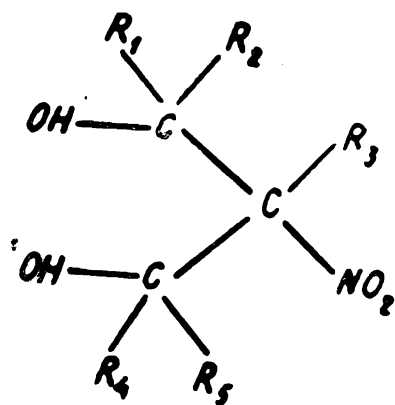
Zastrzeżenia patentowe

- 1 Sposób wytwarzania nowych organicznych pochodnych boru o ogólnym wzorze 1, w którym Z oznacza podstawnik alifatyczny, aryłowy lub heterocykliczny zaś R_1 , R_2 , R_3 , R_4 i R_5 oznaczają dowolny podstawnik np. alkil wolny lub podstawiony, grupę hydroksylową, aminową, chlorowcową itd., znamienny tym, że poddaje się kondensacji kwas alkilo-aryloborowy, lub kwas borowy podstawiony grupą heterocykliczną o ogólnym wzorze $Z-B(OH)_2$ albo bezwodniki tych kwasów, z podstawionym 2-nitropropandiolem-1,3 o wzorze ogólnym 2, w którym R_1 , R_2 , R_3 , R_4 i R_5 mają wyżej podane znaczenie, w temperaturze 30—180°C.
2. Sposób według zastrzeżenia 1, znamienny tym, że proces kondensacji prowadzi się przez ogrzewanie substratów ewentualnie w obecności rozpuszczalnika organicznego polarnego lub niepolarnego, a także w wodzie.

30



Wzór 1



Wzór 2