

URZĄD PATENTOWY



C07D 93/14

BIBLIOTEKA
Urzedu Patentowego
Ministerstwa Przemysłu i Handlu

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ OPIS PATENTOWY

Nr 35140

Kl. 12 p, 4

Société des Usines Chimiques Rhône-Poulenc
(Paryż, Francja)

Sposób wytwarzania pochodnych fenotiazyny

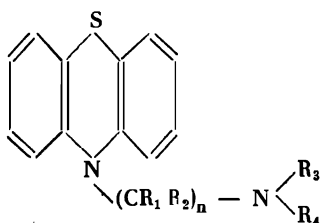
Patent dodatkowy do patentu nr 35139

Udzielono patentu z mocą od dnia 5 stycznia 1948 r.

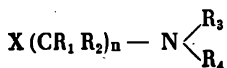
Pierwszeństwo: 14 marca 1947 r. (Francja)

Najdłuższy okres trwania patentu do dnia 5 stycznia 1963 r.

W patencie nr 35139 opisano sposób wytwarzania pochodnych fenotiazyny o ogólnym wzorze:



We wzorze tym R_1 i R_2 oznaczają atomy wodoru lub alkyle niskiego rzędu, R_3 i R_4 — metyl lub etyl, a n — liczbę 2, 3, 4 lub 5, przy czym rdzenie benzenowe mogą ponadto być podstawione resztami alkilowymi lub alkoksylowymi. Sposób ten polega na oddziaływaniu na fenotiazynę, ewentualnie podstawioną, haloidkiem o wzorze ogólnym:



(X — chlorowiec), w obecności środka wiążącego kwas chlorowcowodorowy, zwłaszcza amidku sodu.

Wynalazek niniejszy dotyczy stosowania sposobu, opisanego w wyżej wymienionym patencie, do wytwarzania nowych pochodnych, odpowiadających wyżej podanemu wzorowi ogólnemu, w którym obydwa rodniki R_3 i R_4 , zamiast stanowić metyl lub etyl, oznaczają łącznie dwuwartościowy łańcuch alifatyczny, który ewentualnie może zawierać heteroatom.

Uzyskane w ten sposób nowe pochodne wykazują cenne właściwości farmakodynamiczne.

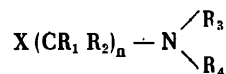
Przykład I. Ogrzewa się do temperatury wrzenia pod chłodnicą zwrotną 20 g fenotiazyny, 80 g ksylenu i 4,8 g 85%-ego amidku sodu. Do mieszaniny tej dolewa się w ciągu godziny 16 g 2-piperidyno-1-chloro-etanu rozpuszczonego w takiej samej ilości wagowej ksylenu. Po dodaniu całej ilości podgrzewa się jeszcze przez godzinę. Po ochłodzeniu roztwór zadaje się wodą i kwasem chlorowodorowym, oddziela war-

stwę ksilenową, alkalizuje wodną warstwę za pomocą sody i zasadę poddaje ekstrakcji za pomocą eteru. Uzyskuje się N-(β -piperydynoetylo-fenotiazynę, wrzącą w temperaturze 210—212°C pod ciśnieniem 2 mm słupa rtęci. Temperatura topnienia chlorowodoru: 169—170°C.

Przykład II. Ogrzewa się do temperatury wrzenia pod chłodnicą zwrotną 20 g fenotiazyny, 80 g ksylenu i 4,8 g 85%-ego amidku sodu. Do mieszaniny tej dolewa się w ciągu godziny 16,6 g 2-morfolino-1-chloroetanu, rozpuszczonego w takiej samej ilości wagowej ksylenu. Roztwór traktuje się w taki sam sposób jak w przykładzie I i uzyskuje N-(β -morfolinoetylo)-fenotiazynę, wrzącą w temperaturze 229—232°C pod ciśnieniem 2 mm słupa rtęci i topiącą się w temperaturze 74°C. Temperatura topnienia chlorowodoru: 184—185°C.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania pochodnych fenotiazyny według patentu nr 35139, znamienny tym, że do reakcji z fenotiazyną stosuje się haloidek o wzorze ogólnym



w którym R_1 i R_2 oznaczają atomy wodoru albo alkile niższego rzędu, X — oznacza atom chlorowca, n — liczbę 2, 3, 4 lub 5, a R_3 i R_4 stanowią łącznie dwuwartościowy łańcuch alifatyczny, który ewentualnie może zawierać heteroatom.

Société des Usines Chimiques
Rhône-Poulenc

Zastępca: Kolegium Rzeczników Patentowych