

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY

55770

Patent dodatkowy
do patentu

Kl. 12 o, 26/03

Zgłoszono: 30.XII.1965 (P 112 267)

Pierwszeństwo:

MKP C 07 d 107/02

Opublikowano: 10.VIII.1968

UKD

Współtwórcy wynalazku: Barbara Serafinowa, Andrzej Jończyk

Właściciel patentu: Grodziskie Zakłady Farmaceutyczne „Polfa” Przedsiębiorstwo Państwowe, Grodzisk Maz. (Polska)

Sposób wytwarzania nowych 4-podstawionych pochodnych boradioksacyklopentanu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych 4-podstawionych pochodnych boradioksacyklopentanu o ogólnym wzorze 1, w którym Z oznacza alkil, aryl lub podstawnik alifatyczny, aromatyczny lub heterocykliczny, zaś X oznacza grupę hydroksylową i jej pochodne, aminową i jej pochodne, karboksylową i jej pochodne, nitrylową lub nitrową.

Związki te wykazują niewielką toksyczność, działają na centralny układ nerwowy oraz są czynne przeciw drobnoustrojom chorobotwórczym.

Sposobem według wynalazku pochodne w ogólnym wzorze 1 otrzymuje się przez kondensację kwasów borowych o wzorze $Z-B(OH)_2$, w którym Z oznacza alkil, aryl lub podstawnik alifatyczny, aromatyczny lub heterocykliczny lub estrów tych kwasów lub ich bezwodników z 1,2-propandiolem podstawionym w położeniu 3 grupą o ogólnym wzorze 2, w którym X znaczenie wyżej podane.

Proces kondensacji prowadzi się według wynalazku stosując molowy stosunek substratów lub stosując nadmiar jednego z nich w rozpuszczalnikach organicznych, jak benzen, aceton lub w innych rozpuszczalnikach polarnych lub niepolarnych, w wodzie lub bez rozpuszczalników w temperaturze 30–150°C. W przypadku stosowania rozpuszczalników proces kondensacji korzystnie prowadzi się w temperaturze wrzenia.

Przykład I. 12,5 g kwasu fenyloborowego i 16,7 g 3-N-fenilo-amino-propandiolu-1,2 ogrze-

2

wa się przez 10 minut w 100 ml acetonu pod chłodnicą zwrotną w temperaturze wrzenia i następnie oddestylowuje rozpuszczalnik. Wydzielony produkt krystalizuje się z acetonu. Otrzymuje się 22,7 g (90% teorii) 2-fenilo-4-feniloamino-metylo-1,3-dioksa-2-boracyklopentanu o temperaturze topnienia 78–82°C.

Przykład II. 1,5 g kwasu p-metoksyfenyloborowego i 2,0 g 3-p-chlorofenoksy-propandiolu-1,2 ogrzewa się do stopienia i produkt krystalizuje z metanolu; otrzymuje się 2,8 g (90% teorii) 2-fenilo-4-(p-chlorofenoksy)-metylo-2-bora-1,3-dioksacyklopentanu o temperaturze topnienia 105–106,5°C.

Przykład III. 1,21 g kwasu fenyloborowego miesza się z 1,8 g 3-(N-benzylidenoaminy)-propandiolu-1,2 i ogrzewa w 10 ml etanolu pod chłodnicą zwrotną w temperaturze wrzenia przez pół godziny.

Po oziębieniu krystalizuje produkt 2-fenilo-4-(N-benzylidenoamino)-metylo-1,3-dioksa-2-boracyklopentanu, który oczyszcza się przez krystalizację z etanolu.

Wydajność produktu w stosunku do teoretycznej wynosi 80%. Temperatura topnienia 68–74°C.

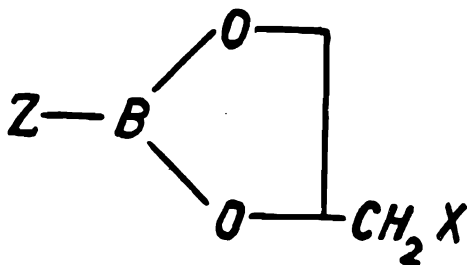
Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania nowych 4-podstawionych pochodnych boradioksacyklopentanu o ogólnym wzorze 1, w którym Z oznacza alkil, aryl

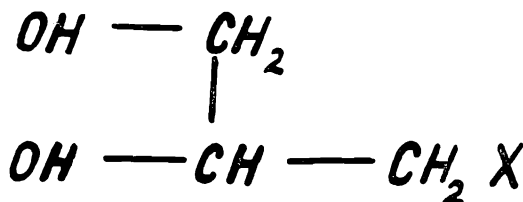
lub podstawnik alifatyczny, aromatyczny lub heterocykliczny, natomiast X oznacza grupę hydroksylową i jej pochodne, aminową i jej pochodne, karboksylową i jej pochodne, nitrylową lub nitrową, **znamienny tym**, że kwasy borowe o wzorze $Z-B(OH)_2$ w którym Z ma wyżej podane znaczenie lub estry tych kwasów lub ich bezwodniki poddaje się kondensacji

z 1,2-propandiolem o ogólnym wzorze 2, w którym X ma podane wyżej znaczenie, w temperaturze 30—150°C.

2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że kondensację prowadzi się przez bezpośrednie ogrzewanie substratów lub w obecności rozpuszczalnika organicznego polarnego lub niepolarnego lub w wodzie.



Wzór 1



Wzór 2