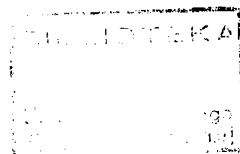


URZĄD PATENTOWY

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ
OPIS PATENTOWY

Nr 15154.

Kl. 12 p 1.

E. Merck
(Darmstadt, Niemcy).**Sposób otrzymywania pochodnych 1-benzyl-3-metylo-izochinoliny.**

Zgłoszono 25 marca 1930 r.

Udzielono 1 grudnia 1931 r.

Pierwszeństwo: 24 sierpnia 1929 r. (Niemcy).

Wiadomo (Bischler i Napieralski, Ber. d. deutsch. chem. Gesellsch. 26 (1893), 1903; Pictet i Finkelstein, Ber. d. deutsch. chem. Gesellsch. 42 (1909) 1979), że amidy kwasowe, otrzymywane przez sprzężenie kwasów fenylo-octowych z 1-fenylo-2-amino-etanami, pod działaniem środków kondensujących, jak chlorku cynkowego pięcio-chlorku fosforu, lub tleno-chlorku fosforu dają się przeprowadzić w benzyl-dwu-hydro-izochinoliny.

Obecnie wykryto, że amidy kwasowe, zawierające, jako składniki zasadowe 1-(4.5 metyleno-dwuoksyfenylo)-2-amino-propan albo 1-(4.5 dwumetoksyfenylo)-2-amino-propan (patent niemiecki Nr

274350) pod wpływem środków kondensujących przechodzą również w benzyl-dwu-hydro-izochinoliny.

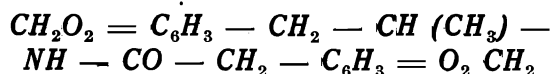
Przez odwodornienie ich można otrzymać zasady, przewyższające działaniem terapeutycznym papawerynę, podczas gdy znane obecnie pochodne papaweryny nie nadają się do celów leczniczych (Mannich i Walter Archiv. der Pharm. 265 (1927) str. 3).

Wiadomo, że dwu- i cztero-hydro-papaweryna działaniem palladu daje się odwodornić na papawerynę (Spaeth i Burger Ber. d. deutsch. chem. Ges. 60 (1927) 704), lecz w tym przypadku każdy z atomów węgla, których pojedyncze wiązanie

ma być przeprowadzone w podwójne, zawiera jeszcze po 2 atomy wodoru.

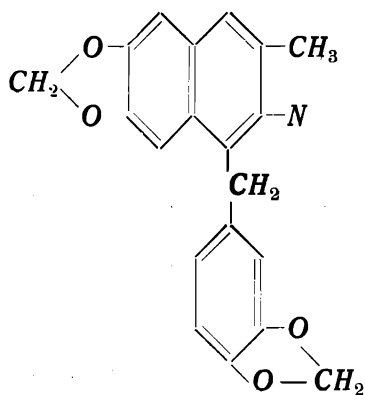
W danym jednakże przypadku idzie o odwodornienie, przy którym jeden z tych atomów zastąpiony jest grupą alkylową, skutkiem czego odwodornienie jest utrudnione a nawet w pewnych razach zupełnie niemożliwe.

Przykład I. 10 części amidu, o wzorze:

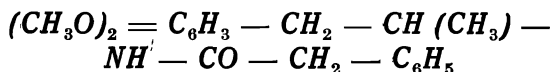


(temperatura topnienia 146°C) rozpuszcza się w 180 cz. gorącego toluenu i ogrzewa z 6 cz. tleno-chlorku fosforu w ciągu 3 godzin do 100°C. Produkt reakcji, wydzielający się w postaci ciemnej, czę-

ściowo krystalicznej masy, oddziela się od toluenu i miesza się ze 100 cz. wody, ogrzewając w ciągu 1/2 godz. poczem sączy się go przez węgiel i poddaje krystalizacji. Chlorowodorek otrzymanej zasady wydziela się w postaci pryzmatów, topiących się w 237°C z rozkładem. Wolna zasada topi się w 71°C. 10 części tej zasady miesza się w ciągu 3 godz. z jedną częścią czerni palladowej w temperaturze około 180°C. Stopioną masę rozpuszcza się w gorącym 4% kwasie solnym, oczyszcza się zapomocą węgla i poddaje krystalizacji. Otrzymany chlorowodorek wydziela się w postaci pryzmatów topiących się w 150°C. Wolna zasada krystalizuje z metanolu w błyszczących pryzmatach o temperaturze topnienia 140°C; posiada wzór:



Przykład II. 10 cz. amidu, o wzorze:



rozpuszcza się w 150 cz. toluenu na ciepło i po dodaniu zawiesiny 10 cz. pięciotlenku fosforu w 20 cz. toluenu gotuje przez 1/2 godz. Po ostygnięciu miesza się produkt reakcji, po oddzieleniu toluenu, ze 100 cz. wody, wygotowuje się z węglem, przesą-

cza i wydziela z roztworu chlorowodorek zasady przez dodanie soli kuchennej. Wolną zasadę odwodarnia się zapomocą ogrzewania z palladem według przykładu I.

Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób otrzymywania pochodnych 1-benzyl-3-metylo-izochinolin, znamieny tem, że amidy kwasowe, dające się o-

trzymać z kwasów fenylo-octowych i 1-(4-5)-metyleno-dwuoksyfenilo - 2 amino-propanu albo 1-(4-5)-dwumetoksyfenolo-2-aminopropanu, poddaje się działaniu kwasnych środków kondensujących i tak otrzymane zasady traktuje odpowiednimi środkami odciągającymi wodór.

2. Sposób według zastrz. 1, znamieny tem, że jako środek odciągający wodór stosuje się pallad.

E. Merck.

Zastępca: I. Myszczyński,
rzecznik patentowy.