



Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 01.XII.1967 (P 123 835)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 31.III.1971

Kl. 12 p, 1/01

MKP C 07 d, 31/22

UKD

Współtwórcy wynalazku: Zdzisław Machoń, Leonard Kuczyński
Właściciel patentu: Farmaceutyczno-Chemiczna Spółdzielnia Pracy
„Labor”, Wrocław (Polska)

Sposób wytwarzania nowych czwartorzędowych soli, pochodnych pirydylofenyloetanu

1

Wynalazek dotyczy sposobu wytwarzania nowych, czwartorzędowych soli, pochodnych pirydylofenyloetanu, o ogólnym wzorze 1, w którym R oznacza atom wodoru, grupę metylową lub etylową, natomiast R' oznacza atom wodoru lub grupę hydroksylową, a R'' oznacza grupę metylową lub etylową. Związków tych dotychczas nie opisano w literaturze. Nowe związki, wytwarzane sposobem według wynalazku, posiadają cenne właściwości chemoterapeutyczne, np. wykazują silne działanie przeciwbakteryjne i przeciwnowotworowe.

Związki o wzorze 1, w którym wszystkie podstawniki, mają wyżej podane znaczenie, otrzymuje się na drodze reakcji pochodnych α , β , γ pirydylofenyloetanu o wzorze 2, w którym R i R' mają wyżej podane znaczenie, z chlorowodorkiem chloru dwualkiloaminoetylowego o wzorze 3, w którym R'' ma wyżej podane znaczenie, w środowisku alkoholi alifatycznych zawierających 3—5 atomów węgla takich jak: alkohol n-propylowy, izopropylowy, n-butyłowy, amylowy lub izoamylowy.

Reakcję prowadzi się stosując wyżej wymienione materiały wyjściowe w środowisku odpowiedniego, bezwodnego alkoholu, ponieważ nawet śladowe ilości wody wpływają ujemnie na wydajność kondensacji.

Korzystne jest prowadzenie reakcji w temperaturze wrzenia alkoholu stosowanego jako rozpuszczalnik, stosując na 1 mol pochodnej piry-

2

dylofenyloetanu 0,92 mola chlorowodorku chloru dwualkiloaminoetylowego w ciągu 18 godz.

Przykład: W 130 ml bezwodnego alkoholu n-butyłowego rozpuszcza się 13 g 4-pirydylofenyloetanu. Do roztworu dodaje się 8,8 g chlorowodorku chloru dwumetyloaminoetylowego i mieszaninę ogrzewa się 18 godz. w temperaturze

10	R	R'	R''	Położenie	Wzór sumaryczny	Temperatura topnienia *) w°C	Wydajność %
	H	OH	CH ₃	α	C ₁₇ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O	165—165,5	67
15	H	H	CH ₃	α	C ₁₇ H ₂₄ Cl ₂ N ₂	167—169	68
	H	H	C ₂ H ₅	α	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂	168—169	72
	CH ₃	OH	CH ₃	α	C ₁₉ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O	236—238	42
	CH ₃	H	CH ₃	α	C ₁₉ H ₂₆ Cl ₂ N ₂	202—204	38
	C ₂ H ₅	OH	CH ₃	α	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂ O	204—206	30
	C ₂ H ₅	H	CH ₃	α	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂	220—224	44
20	C ₂ H ₅	OH	C ₂ H ₅	α	C ₂₁ H ₃₂ Cl ₂ N ₂ O	198—201	28
	CH ₃	OH	CH ₃	β	C ₁₉ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O	157—160	83
	CH ₃	H	CH ₃	β	C ₁₉ H ₂₆ Cl ₂ N ₂	154—156	57
	CH ₃	H	C ₂ H ₅	β	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂	150—152	32
	H	OH	CH ₃	γ	C ₁₇ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O	204—205	80
	H	H	CH ₃	γ	C ₁₇ H ₂₄ Cl ₂ N ₂	188—189	61
25	H	OH	C ₂ H ₅	γ	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂ O	172—174	61
	H	H	C ₂ H ₅	γ	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂	208—209	61
	C ₂ H ₅	OH	CH ₃	γ	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂ O	208—210	58
	C ₂ H ₅	H	CH ₃	γ	C ₁₉ H ₂₈ Cl ₂ N ₂	223—225	55
	C ₂ H ₅	OH	C ₂ H ₅	γ	C ₂₁ H ₃₂ Cl ₂ N ₂ O	186—189	56
	C ₂ H ₅	H	C ₂ H ₅	γ	C ₂₁ H ₃₂ Cl ₂ N ₂	213—215	74

*) Temperatury topnienia niekorygowane

wrzenia rozpuszczalnika. Następnie rozpuszczalnik oddestylowuje się pod zmniejszonym ciśnieniem, a pozostałość krystalizuje się z bezwodnego etanolu. Uzyskuje się 13,6 g chlorowodoru chlorku N-dwumetyloaminoetylo-4-pirydylofenyloetylowego.

Analogicznie, jak opisano w powyższym przykładzie, wytwarzane są związki o wzorze 1, w którym podstawniki mają takie znaczenie jak podane w tabeli.

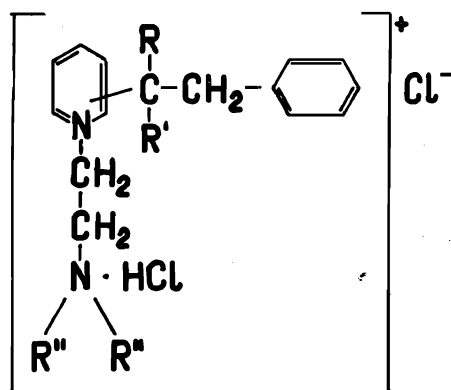
Niektóre z otrzymanych soli są silnie higroskopijne. Wydajność: od 30—80%.

Zastrzeżenia patentowe

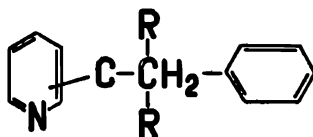
1. Sposób wytwarzania nowych czwartorzędo-

wych soli, pochodnych pirydylofenyloetanu o wzorze 1, w którym R oznacza atom wodoru, grupę metylową lub etylową, R' oznacza atom wodoru lub grupę hydroksylową, a R'' oznacza grupę metylową lub etylową, **znamienny tym**, że pochodne pirydylofenyloetanu o wzorze 2, w którym R i R' mają wyżej podane znaczenie poddaje się reakcji z chlorowodorkiem chlorku dwualkiloaminoetylowego o wzorze 3, w którym R'' ma wyżej podane znaczenie.

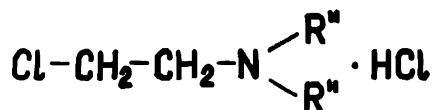
2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że reakcję prowadzi się w środowisku alkoholi alifatycznych zawierających 3—5 atomów węgla, np. w alkoholu n-propylowym, izopropylowym, n-butylo-
15 tylowym, amylowym lub izoamylowym.



Wzór 1



Wzór 2



Wzór 3