



Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 11.VIII.1969 (P 135 329)

Pierwszeństwo: _____

Opublikowano: 10.IV.1972

Kl. 12 q, 32/20

~~07/140~~
MKP C 07 c 49/78

UKD

Współtwórcy wynalazku: Włodzimierz Daniewski, Włodzimierz Daniewski jr, Marian Borówka, Roman Szymański

Właściciel patentu: Przedsiębiorstwo Doświadczalne Przemysłu Farmaceutycznego „Polfa”, Warszawa (Polska)

Sposób otrzymywania chlorowodorku 3,5 -dwohydroksy-izopropylu aminoacetofenonu

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania chlorowodorku 3,5-dwohydroksyizopropylaminoacetofenonu.

Dotychczasowe metody otrzymywania 3,5-dwohydroksyizopropylaminoacetofenonu polegały na działaniu bromkiem 3,5-dwuacetoksyfenacylu na izopropylaminę w roztworach węglowodorów aromatycznych w których bromek jest łatwo rozpuszczalny. Wydajność w tych warunkach nie przekracza 25%, gdyż tworzy się równocześnie amina trzeciorzędowa, gdyż powstały 3,5-dwohydroizopropylaminoacetofenon reaguje dalej z drugą cząsteczką bromku. Dzieje się to zwłaszcza w rozpuszczalnikach węglowodorowych, które nie tworzą kompleksów z propylaminoacetofenonem. Natomiast w alkoholach, zwłaszcza w etylowym, powstaje kompleks, który trudniej reaguje z bromkiem, dzięki czemu otrzymuje się mniej aminy trzeciorzędowej.

Węglowodory nie dają kompleksów z aminami, natomiast alkohole dają, powiększając wymiar cząsteczki aminy, co zapobiega tworzeniu aminy trzeciorzędowej ze względów sferycznych, gdyż bromek reaguje łatwo z izopropylaminą w kompleksie alkoholowym natomiast już trudno z aminą drugorzędową w kompleksie z alkoholem.

Stwierdzono, że można uzyskać wydajność sięgającą do 45% stosując jako rozpuszczalnik alkohol etylowy.

2

Przykład. 240 ml izopropylaminy rozpuszczonej w 240 ml etanolu zadaje się w temperaturze 35°C roztworem 160 g bromku 3,5-dwuacetoksyfenacylu w 1 l etanolu, ogrzewa do temperatury 35°C przez 1 godzinę po czym zakwasza stężonym kwasem solnym i przez destylację usuwa etanol oraz octan etylu powstały na skutek transestryfikacji grup acetylowych. Po odpędzeniu rozpuszczalników dodaje się 600 ml acetonu i 200 ml eteru etylowego. Wytrącony chlorowodorek 3,5-dwohydroksyizopropylaminoacetofenonu odsącza się, przemywa acetonem i suszy. Wydajność 55 g czyli 45% wydajności teoretycznej o punkcie topliwości 220°C.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób otrzymywania chlorowodorku 3,5-dwohydroksyizopropylaminoacetofenonu na drodze reakcji bromku 3,5-dwuacetoksyfenacylu z izopropylaminą w środowisku rozpuszczalnika organicznego, **znamienny tym**, że reakcję prowadzi się w roztworze alkoholu etylowego.