

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY

66771

Patent dodatkowy
do patentu _____

Kl. 12o,17/04

Zgłoszono: 13.IV.1968 (P 126 437)

Pierwszeństwo: _____

MKP C07c 129/12

Opublikowano: 15.V.1973

UKD

Współtwórcy wynalazku: Czesław Belżecki, Stanisław Pęksa

Właściciel patentu: Polska Akademia Nauk (Instytut Chemii Organicznej),
Warszawa (Polska)

Sposób wytwarzania 2-hydroksy-2-fenylo-etyloguanidyny

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania 2-hydroksy-2-fenyloetyloguanidyny o wzórze przedstawionym na rysunku. Związek ten posiada ciekawe właściwości farmakologiczne, potęguje bowiem efekt ciśnieniowy adrenaliny lub noradrenaliny i poważnie osłabia wpływ tyraminy.

Znany sposób wytwarzania tego związku polega na reakcji S-metylo-izo-tiomocznika z β -fenylo- β -hydroksyetyloaminą. W reakcji powstaje 2-hydroksy-2-fenyloetyloguanidyna i merkaptan metylo-owy, co ze względu na toksyczne działanie i odrażającą woń tego związku czyni metodę uciążliwą, a ponadto 2-hydroksy-2-fenyloetyloamina jest trudno dostępna.

Celem wynalazku jest usunięcie tych niedogodności i opracowanie sposobu wytwarzania 2-hydroksy-2-fenylo-etyloguanidyny z łatwo dostępnych surowców.

Stwierdzono, że cel ten uzyskuje się, jeżeli tlenek styrenu poddaje się reakcji z wolną guanidyną, a produkt reakcji wyodrębnia się w postaci soli.

Reakcję według wynalazku prowadzi się w rozpuszczalniku polarnym, korzystnie w alkonolu, a najlepiej w etanolu lub metanolu w temperaturze wrzenia, używając stechiometrycznych ilości substratów względnie niewielkiego nadmiaru guanidyny. Produkt reakcji wyodrębnia się, jak to już wyżej podano w postaci soli, za pomocą słabego kwasu, korzystnie kwasu węglowego.

2

Przykład. 12,0 g (0,1 mola) tlenku styrenu i 5,9 g (0,1 mola) wolnej guanidyny rozpuszczonej w 150 ml absolutnego etanolu poddano ogrzewaniu pod chłodnicą zwrotną w ciągu 4 godzin zabezpieczając jednocześnie przed wpływem wilgoci i CO₂ z atmosfery. Następnie etanol oddestylowuje się a pozostałość rozpuszcza się w 96% etanolu i nasyca się roztwór CO₂ aż do zakończenia wytrącania osadu. Produkt końcowy wyodrębnia się z wydajności 74% o temperaturze topnienia 143 — 4°C (z rozkładem)

Analiza elementarna dla wzoru C₉H₁₃ON₃ 1/2 H₂CO₃ obliczono C 54,27% H 6,71% N 19,99%
znaleziono C 54,25% H 6,66% N 19,89%.

15

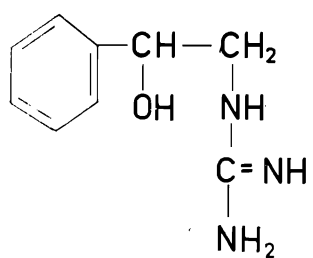
Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania 2-hydroksy-2-fenyloetyloguanidyny o wzórze przedstawionym na rysunku **znamienny tym**, że tlenek styrenu poddaje się reakcji z wolną guanidyną, a produkt reakcji wyodrębnia się w postaci soli.

2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że produkt reakcji przeprowadza się w sól za pomocą słabego kwasu nieorganicznego, korzystnie kwasu węglowego.

3. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że reakcję prowadzi się w polarnym rozpuszczalniku organicznym, korzystnie w alkonolu, najlepiej w etanolu lub metanolu.

30



wzór