

Opublikowane dnia 11 maja 1963 r.



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 46856

Kl. 12 p, 6
Kl. internat. C 07 d

May & Baker Limited

Dagenham, Wielka Brytania

Sposób wytwarzania pochodnych piperazyny

Patent trwa od dnia 19 października 1960 r.

Pierwszeństwo: 20 października 1959 r. (Wielka Brytania)

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych piperazyny o wzorze 1, w którym R_1 oznacza atom wodoru lub rodnik trójfluorometylowy, jak również ich soli addycyjnych z kwasami.

Związki otrzymane sposobem według wynalazku są ciekawymi produktami ze względu na ich pochodne, podstawione w pozycji 4 pierścienia piperazyny, które wykazują pożyteczne właściwości farmakodynamiczne.

Wśród związków tych należy zwłaszcza wymienić 1-/3'-trójfluorometylofenylo/-4-/2'-(2"-fenylo lub 3"-podstawione)-etylo/-piperazyny i 1-/3', 5'-bis-trójfluorometylofenylo/-4-/2'-(2"-fenylo lub 3" podstawione)-etylo/-piperazyny, które posiadają ciekawe właściwości psychotropowe.

Związki o wzorze 1 w postaci ich soli addycyjnych z kwasami można wytworzyć korzystnie przez działanie pochodnej aniliny o wzorze

2 na dwuetanoloaminę w obecności mocnego kwasu w środowisku wodnym, zatężonym na gorąco.

Otrzymaną sól addycyjną można następnie na żądanie przeprowadzić w zasadę o wzorze 1.

Przytoczone przykłady wyjaśniają wynalazek, nie ograniczając jego zakresu.

Przykład I. Mieszaninę 200 g m-trójfluorometyloaniliny, 132 g dwuetanoloaminy i 285 cm³ 48—50%-owego (wagowo) kwasu bromowodorowego ogrzewa się do temperatury 180°C w ciągu 2 godzin. Następnie utrzymuje się temperaturę 180—200°C w ciągu 3 godzin, po czym odstawia mieszaninę do ochłodzenia. Produkt stały przekształca się w wodzie, a następnie w etanolu i otrzymuje 215 g (bądź 56%) bromowodoru N-3-trójfluorometylofenylo-piperazyny, topniejącej w temperaturze 250—253°C.

Przykład II. Zastępując m-trójkfluorometyloanilinę 3,5-bis-(trójkfluorometylo)-aniliną wytwarza się takim samym sposobem, jak w przykładzie I bromowoderek N-3-5-bis-(trójkfluorometylo)-fenylopiperyzny, o wydajności 49% i temperaturze topnienia około 340°C z rozkładem.

Zastrzeżenia patentowe

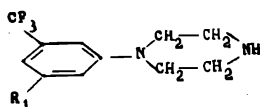
1. Sposób wytwarzania pochodnych piperazy-ny o wzorze 1, w którym R_1 oznacza atom wodoru lub rodnik trójkfluorometylowy, jak również ich soli addycyjnych z kwasami,

znamienny tym, że poddaje się reakcji pochodną aniliny o wzorze 2 z dwuetanoloaminą w obecności mocnego kwasu w środowisku wodnym, zatężonym na gorąco, po czym na żądanie wyosabnia się zasadę.

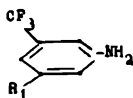
2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że jako kwas stosuje się kwas bromowodorowy.

May & Baker Limited

Zastępca: inż. J. Felkner
rzecznik patentowy



WZOR 1



WZOR 2