



(19) KG (11) 141 (13) C2

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО

(51)<sup>6</sup> C07C 233/00, 231/00

ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ**

к патенту Кыргызской Республики

(10) 659082

(21) 2484453/SU

(22) 31.05.1977

(46) 01.10.1996, Бюл. №2, 1997

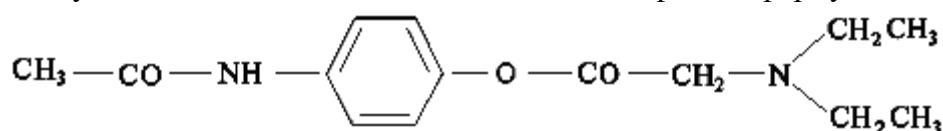
(71)(73) Эксасими, FR

(72) Жан-Клод Коньяк, FR

(56) 1. Вейганд-Хильгетаг. Методы эксперимента в органической химии. - Химия, 1968. - С. 413-431.

2. Машковский М.А. Лекарственные вещества. - Т. 2. - М.: Медицина, 1972. - С. 110 (54)  
**Способ получения диэтиламиноацетата n - ацетамидофенола или его хлоргидрата**

(57) Способ получения диэтиламиноацетата n - ацетамидофенола формулы



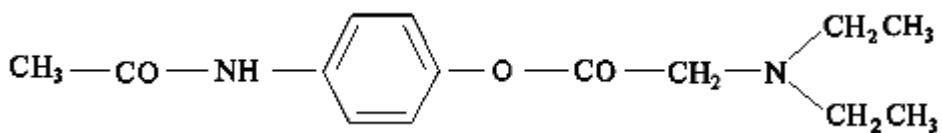
или его хлоргидрата, отличающийся тем, что галоидациетат n - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галоидводородной кислоты, полученный продукт выделяют в свободном виде или в виде хлоргидрата.

Предлагается способ получения нового производного n - ацетамидофенола, в частности диэтиламиноацетата n - ацетамидофенола или его хлоргидрата, которые могут быть использованы в качестве физиологически активных соединений.

В литературе описано присоединение вторичных аминов к галоидпроизводным в присутствии акцептора галоидводородной кислоты при нагревании [1].

Целью изобретения является способ получения не описанного в литературе производного n - ацетамидофенола, обладающего преимуществами по сравнению с соединением аналогового назначения, n - ацетамидофенолом [2].

Предлагаемый способ получения диэтиламиноацетата n-ацетамидофенола формулы



или его хлоргидрата отличается тем, что галоидацетат *n* - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галоидводородной кислоты, полученный продукт выделят в свободном виде или в виде хлоргидрата.

Предлагаемые продукты хорошо растворяются в воде, их водные растворы являются стойкими во времени.

Данный способ ведут при 40-50°C. В качестве акцептора кислоты может быть использован избыток диэтиламина или триэтиламин.

Хлоргидрат получают известным способом - присоединением соответствующей кислоты к диэтиламиноацетату *n* - ацетамидофенола.

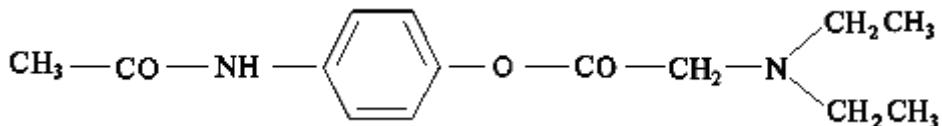
Пример 1. В 40 см<sup>3</sup> диэтиламина добавляют небольшими порциями при перемешивании 22.8 г хлорацетата *n* - ацетамидофенола, поддерживая температуру, если это необходимо, 40-50°C с помощью охлаждения холодной водой. По окончании экзотермической реакции смесь оставляют при перемешивании на 2 ч при 45°C, охлаждают ее, разбавляют 250 см<sup>3</sup> воды со льдом. После извлечения эфира последний высушивают на сульфате магния и выпаривают эфир в вакууме, получают диэтиламиноацетат *n* - ацетамидофенола в виде густого маслянистого остатка, который обрабатывают 10 см<sup>3</sup> петролейного эфира, затем оставляют на 2 ч, выпавшие при этом кристаллы отделяют фильтрованием, промывают 50 см<sup>3</sup> петролейного эфира, сушат и получают 14.7 г чистого диэтиламиноацетата *n* - ацетамидофенола, т.пл. 70°C.

Для получения соответствующего хлоргидрата растворяют остаток в 150 см<sup>3</sup> ацетона, подкисливают эфир хлористоводородной кислотой до pH 1, дают отстояться в течение 1 ч, затем фильтруют, промывают ацетоном, высушивают и получают 13.2 г кристаллов хлоргидрата диэтиламиноацетата *n* - ацетамидофенола, т.пл. 109°C.

Пример 2. В раствор из 7.5 г диэтиламина в 30 см<sup>3</sup> триэтиламина добавляют небольшими порциями при перемешивании 22.8 г хлорацетата *n* - ацетамидофенола, поддерживая, если это необходимо, температуру 40-50°C с помощью охлаждения холодной водой. Затем действуют, как в примере 1, и получают 12 г хлоргидрата диэтиламиноацетата *n* - ацетамидофенола, т.пл. 109°C.

### Формула изобретения

Способ получения диэтиламиноацетата *n* - ацетамидофенола формулы



или его хлоргидрата, отличающийся тем, что галоидацетат *n* - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галоидводородной кислоты, полученный продукт выделяют в свободном виде или в виде хлоргидрата.

Ответственный за выпуск

Ногай С.А.

---

Кыргызпатент, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41, факс: (312) 68 17 03