

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

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁶ **C07C 233/00, 231/00**

(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) Эксашими, FR

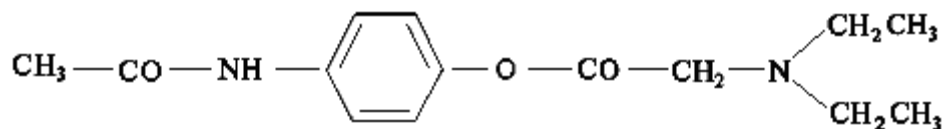
(72) Жан-Клод Коньяк, FR

(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 п - ацетамидофенола или его хлоргидрата

(57) Способ получения диэтиламиноацетата п - ацетамидофенола формулы



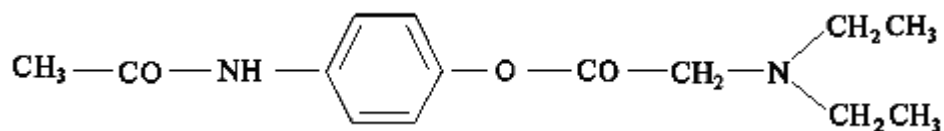
или его хлоргидрата, отличающийся тем, что галоидацетат п - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галоидводородной кислоты, полученный продукт выделяют в свободном виде или в виде хлоргидрата.

Предлагается способ получения нового производного п - ацетамидофенола, в частности диэтиламиноацетата п - 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 п - ацетамидофенола, обладающего преимуществами по сравнению с соединением аналогового назначения, п - ацетамидофенолом [2].

Предлагаемый способ получения диэтиламиноацетата п-ацетамидофенола формулы



или его хлоргидрата отличается тем, что галоидацетат п - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галогидводородной кислоты, полученный продукт выделяют 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 п - ацетамидофенола.

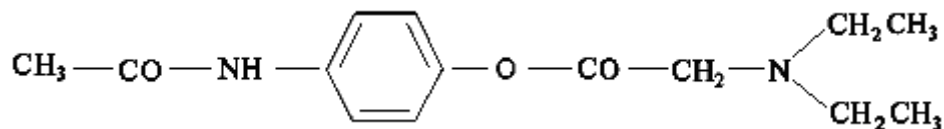
Пример 1. В 40 см³ диэтиламина добавляют небольшими порциями при перемешивании 22.8 г хлорацетата п - ацетамидофенола, поддерживая температуру, если это необходимо, 40-50°C с помощью охлаждения холодной водой. По окончании экзотермической реакции смесь оставляют при перемешивании на 2 ч при 45°C, охлаждают ее, разбавляют 250 см³ воды со льдом. После извлечения эфира последний высушивают на сульфате магния и выпаривают эфир в вакууме, получают диэтиламиноацетат п - ацетамидофенола в виде густого маслянистого остатка, который обрабатывают 10 см³ петролейного эфира, затем оставляют на 2 ч, выпавшие при этом кристаллы отделяют фильтрованием, промывают 50 см³ петролейного эфира, сушат и получают 14.7 г чистого диэтиламиноацетата п - ацетамидофенола, т.пл. 70°C.

Для получения соответствующего хлоргидрата растворяют остаток в 150 см³ ацетона, подкисляют 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 п - ацетамидофенола, т.пл. 109°C.

Пример 2. В раствор из 7.5 г диэтиламина в 30 см³ триэтиламина добавляют небольшими порциями при перемешивании 22.8 г хлорацетата п - 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 п - ацетамидофенола, т.пл. 109°C.

Формула изобретения

Способ получения диэтиламиноацетата п - ацетамидофенола формулы



или его хлоргидрата, отличающийся тем, что галоидацетат п - ацетамидофенола подвергают взаимодействию с эквимолекулярным количеством диэтиламина в присутствии акцептора галогидводородной 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