

(19) **KG** (11) **56** (13) **C2**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО  
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ  
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)<sup>5</sup> **C07D 461/00**

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

### к патенту Кыргызской Республики

---

(10) 1435153

(21) 4028528/SU

(22) 19.11.1986

(31) 549.105

(32) 20.11.1985

(33) ES

(46) 01.02.1995, Бюл. №2, 1996

(71) (73) Ковекс С.А., ES

(72) Фернандо Кальво Мондело, ES

(56) Патент ФРГ №2265138, кл. C07D 471/22, 1977

Патент ФРГ №2253750, кл. C07D 471/22, 1978

**(54) Способ получения сложного этилового эфира аповинкаминовой кислоты**

(57) Изобретение относится к гетероциклическим соединениям. Цель изобретения - повышение выхода целевого продукта и упрощение процесса. Синтез ведут путем этерификации аповинкаминовой кислоты этиловым спиртом в среде ацетонитрила. Процесс проводят в присутствии 2-фтор-1, 3, 5-тринитробензола и 4-диметиламинопиридина в качестве агента этерификации при комнатной температуре в течение 3-5 ч. Выход увеличивается до 92 % от теоретического. Т. пл. 148-151°C.

Изобретение относится к усовершенствованному способу получения известного производного класса винкаминовых алкалоидов, именно этилового эфира аповинкаминовой кислоты.

Цель изобретения - повышение выхода целевого продукта и упрощение процесса.

Это достигается применением в качестве агентов этерификации 2-фтор-1,3,5-тринитробензола и 4-диметиламинопиридина, использования ацетонитрила в качестве растворителя, что позволяет проводить процесс при комнатной температуре.

Пример. К раствору 5 г аповинкаминовой кислоты и 3.6 г 2-фтор-1,3,5-тринитробензола в 100 мл ацетонитрила добавляют 3.6 г 4-диметиламинопиридина и 5 мл абсолютированного этилового спирта. Реакционную смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 4 ч. По истечении указанного промежутка времени отфильтровывают нерастворимые соли, растворитель отгоняют в вакууме и очищают остаток, пропуская его через колонку, наполненную силикагелем, используя в качестве

элюента 1,2-дихлорэтан. Растворитель отгоняют в вакууме, а получаемый при этом остаток перекристаллизовывают из абсолютного спирта. Таким образом, получают 4.75 г этилового эфира аповинкаминовой кислоты с выходом 92 % от теоретического. Т. пл. 148-151°C,  $(\alpha)_{20}^D = +114.3^\circ$  (пиридин,  $c=1$ ).

#### Формула изобретения

Способ получения сложного этилового эфира аповинкаминовой кислоты путем этерификации аповинкаминовой кислоты этиловым спиртом в среде органического растворителя в присутствии агента этерификации, отличающийся тем, что, с целью повышения выхода целевого продукта и упрощения процесса, в качестве органического растворителя используют ацетонитрил и процесс проводят в присутствии 2-фтор-1, 3, 5-тринитробензола и 4-диметил-аминопиридина в качестве агента этерификации при комнатной температуре в течение 3 - 5 ч.

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