

KRALJEVINA SRBA, HRVATA I SLOVENACA

UPRAVA ZA ZAŠTITU

Klasa 12 (5)



INDUSTRIJSKE SVOJINE

Izdan 1. Aprila 1927.

PATENTNI SPIS BR. 4168

Deutsche Gold & Silber Scheideanstalt vorm. Roessler, Frankfurt na Majni.

Postupak za spravljanje novih heterocikličnih jedinjenja.

Dopunski patent uz osnovni patent broj 4026.

Prijava od 9. jula 1925.

Važi od 1. marta 1926.

Najduže vreme trajanja do 30. novembra 1940.

Shodno glavnom patentu broj 4026, dolazi se do supstitucionih proizvoda piridina od velike vrednosti na taj način, što se diacoputem uvede arsen u jedinjenja piridin serije.

Dalja ispitivanja pokazala su, da se istim putem u piridin derivate može uvesti i jod i na taj se način može doći do novih piridin-jedinjenja od velike vrednosti.

U izvođenju pronalaska može se na pr. postupati tako, da se na diaco-rastvore, koji se na pr. mogu dobiti uobičajenim metodama iz amino-piridin derivata, reaguje telima, koja sadrže jod koji treba uvesti na pr. jod-kalijumom.

Polazi li se na pr. od jednog derivata 5-ili 3-amino-piridina, koji je srazmerno lako pristupačan, onda se diacotiranjem i dejstvom kalium-jodida na pr. na diaco-rastvor reakcijom, koja se razvija potpuno glatko dolazi do tela, kod kojih se jod nalazi u položaju 5-odn. 3.

Shodno pronalasku može se doći do jod-piridin jedinjenja, koja se odlikuju jakim katericidnim dejstvom i to naročito tada, kad pored joda ima još elektronegativnih supstituenata kao na pr. hidroksil-grupa, hlor i t. sl. Prema tome se s uspehom prerađuju lakva tela, koja sadrže supstituente pomenute vrste.

Primeri:

1. 36 gr. 2—5-diamino-piridin-hlor-hidrat rastvore se u 150 sm³ vode i doda se 200 sm³ 10%ne sumporne kiseline. Zatim se diacotira na uobičajeni način dodajući rastvor od 14 gr. natrium-nitrita u 250 sm³ vode. Dobivenom diaco-rastvoru dodaje se postepeno rastvor od 10 gr. kalium-jodida u 40 sm³ vode. Po završetku reakcije, koja je obeležena jakim penušanjem, ostavi se da rastvor stoji duže vremena, zagrevajući eventualno. Zatim se tečnost jako alkališe konc. natrijum-hidroksidom, pa se nagrađeni 2-amino-5-jod piridin isteruje vodenom parom. Pri tome se telo izdvoji u belim kristalnim ljuščicama, koje se, pošto se destilat ohladi, ocede na pumpi i po sušenju u vakumu imaju tačku topljenja 129°. Onaj deo, koji ostaje još rastvoren u destilatu može se dobiti na pr. ekstrakcijom sa etrom.

2. 100 gr. 2-oksi-5-amino-piridin-hlorhidrata rastvore se u 300 sm³ vode i tome se doda 300 sm³ konc. hlorovodonične kiseline. Amin se zatim diacotira na uobičajeni način dodatkom 47 gr. natrijum-nitrita u 200 sm³ vode. U taj diaco-rastvor sipa se u tankom mlazu rastvor od 350 gr. kalium-jodida u 350 sm³ vode mešajući jako. Zatim se kratko vreme zagreva na kupatilu, pa se zatim reakciona smeša ostavi duže

vremena da stoji. Pri tome se odvaja mrko obojeni proizvod, koji prelazi u natriumovu so 2-oksi-5-jod-piridina, kad se na njega djeluje koncentrisanim natrium-hidrok-sidom. Prekristalisanjem iz vode dobija se natrijumova so u čistom obliku. Kad se na ovu so djeluje kiselinama, korisno je u-voditi ugljenu kiselinu u vodeni rastvor soli, onda se taloži slobodan 2-oksi-5-jod-piridin. Tačka topljenja 191—192°.

3. 2-hlor-5-amino-piridin diacotira se na uobičajeni način u kiselom rastvoru sa natrium-nitritom. Dobiveni diaco-rastvor doda se rastvoru jodkalijuma. Reakcija nastupa odmah uz burno razvijanje azota. Alkalizira-njem i destilacijom sa vodenom parom do-bija se 2-hlor-5-jodpiridin u belim ljusti-cama, čija je tačka topljenja 99°.

4. 2-oksi-3-aminopiridin diacotira se na uobičajeni način. Djelujući na diaco ras-tvor na isti način kako je to opisano kod primera 3, dobija se 2-oksi-3-jodpiridin, čija natrijumova so prestavlja kristale, koji se u vodi lako rastvaraju.

Hlor-brompiridin spravljani je već na taj na-čin, što se jednom rastvoru bakra sulfata, kalium-bromida, sumporne kiseline i bakar-nih opiljaka, koja je kuvana do razbojadi-sanja, doda hlor-amino piridin pa zatim ra-

stvor nitrifa. Brom jedinjenje dobijeno na taj način nema terapeutsku vrednost. Na suprot tome dolazi se shodno datom pro-nalasku do jod-piridin jedinjenja koja se odlikuju neobično visokim baktericidnim osobinama i imaju veliku terapeutsku vred-nost.

Patentni zahtevi:

1. Postupak za spravljanje novih hetero-cikličnih jedinjenja shodno patentu br. 4026 naznačen time, što se jod diaco-pulem u-vede u derivate piridina, na pr. tako, što se na diaco-rostvove doličnih piridin deri-vata djeluje telima, koja sadrže jod, na pr. kalium-jodidom.

2. Postupak shodno zahtevu 1, naznačen time, što se derivati amino-piridina, naročito takvi, kod kojih je amino-grupa u 5- odn. 3-položaju, diacotiraju, pa se na tako dobi-vene diaco-rastvore reaguje telima, koja, sadrže jod na pr. alkalnim jedinjenjima.

3. Postupak shodno zahtevima 1—2, na-značen time, što se kao polazna tela uzi-maju takvi derivati piridina, koji imaju sup-stituente elektronegativne prirode, na pr. hidroksilnu grupu.