



Республика Таджикистан

(19) TJ (11) 7

(51) 4 C 07 D 461/00

ГОСУДАРСТВЕННОЕ ПАТЕНТНОЕ  
ВЕДОМСТВО

(12) **Описание изобретения**  
К ПАТЕНТУ

---

---

(60) 1435153 SU, 19861119

(21) 94000042

(22) 19940920

(31) 549.105

(32) 19851120

(33) ES

(46) 19960716

(71) Ковекс, С.А. (ES)

(72) Фернандо Кальво Мондело (ES)

(73) Ковекс, С. А. (ES)

(56) Патент ФРГ № 2265138, кл. С 07 D 471/22, 1977.

Патент ФРГ № 2253750, кл. С 07 D 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 течении 3-5 ч. Выход увеличивается до 92% от теоретического. Т. пл. 148-151 °С.

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, что 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 абсолютного 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°С,  $(\alpha)_{20}^D = +114,3^0$  (пиридин, с = 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-диметиламинопиридина в качестве агента этерификации при комнатной температуре в течение 3-5 ч.