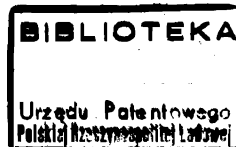


Warszawa, 10 listopada 1936 r.

URZĄD PATENTOWY

A 61 k 27/10²

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 23814.

Kl. 30 h, 2.

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft
(Bazylea, Szwajcaria).

Sposób wytwarzania soli sodowej kwasu N-metylo-C,C-alylo-izopropilo-barbiturowego w postaci trwałej, suchej i bardzo łatwo rozpuszczającej się w wodzie.

Zgłoszono 14 maja 1936 r.

Udzielono 4 września 1936 r.

Pierwszeństwo: 16 maja 1935 r. (Niemcy).

Wytwarzanie soli sodowej kwasu *N* - metylo - C,C - alylo - izopropilo - barbiturowego w postaci trwałej, suchej i bardzo łatwo rozpuszczalnej w wodzie następuje z trudnością. Jeżeli roztwory tej soli odparowuje się do sucha, to otrzymuje się masę grubokrystaliczną. W takiej postaci sól ta nie nadaje się do użytku leczniczego, ponieważ jest trudna do dawkowania i trudno rozpuszcza się w wodzie. O ile tę sól stałą znacznie się rozdrobni, to można ją wprawdzie szybciej przeprowadzić do roztworu wodnego, występuje jednak obawa jej rozkładu wskutek pochłaniania wilgoci i dwutlenku węgla. Wydzielenie zaś soli tej przez wytrącenie z roztworów nie jest

możliwe, ponieważ nawet stężone roztwory tej soli w alkoholu absolutnym mieszają się z acetonem, eterem lub benzenem.

Dozowanie soli higroskopijnych w celu zastosowania ich do wstrzykiwań może być uskuteczniane sposobem według patentu szwajcarskiego Nr 153 032 tak, iż do ampulek wprowadza się roztwory soli tych w alkoholu absolutnym, poczem alkohol odparowuje się w próżni. Sól sodową kwasu *N* - metylo - C,C - alyloizopropilo - barbiturowego według tego sposobu nie daje się otrzymać z wynikiem zadowalającym. Sól ta po odparowaniu alkoholu pozostaje w postaci grubych, zbitych kryształów i może być przeprowadzona do roz-

tworu wodnego jedynie przez długotrwałe silne wstrząsanie.

Obecnie znaleziono, że można wytworzyć sól sodową kwasu *N* - metylo - C,C - alylo - izopropylo - barbiturowego, łatwo rozpuszczającą się w wodzie, o ile odparowanie roztworu alkoholowego w ampułkach przeprowadzi się w sposób szczególny. W przeciwieństwie do zwykłych sposobów odparowywanie przeprowadza się pod ciśnieniem zmniejszonym z początku bardzo powoli w temperaturze zwykłej, najlepiej bez ogrzewania na kąpieli wodnej. Skoro roztwór zostanie odparowany do konsystencji syropu, ogrzewa go się szybko. Przy szybkim odparowaniu pozostałej reszty alkoholu zawartość ampułek krzepnie, wzdymając się jednocześnie i tworząc stałą masę o dużej objętości. W tej postaci sól ta rozpuszcza się wyjątkowo łatwo w wodzie, tak że roztwór, odpowiedni do wstrzyknięcia, może być otrzymany w krótkim czasie.

Sól sodową kwasu *N* - metylo - C,C - alyloizopropylo - barbiturowego w postaci trwałej, suchej i bardzo łatwo rozpuszczającej się w wodzie wytwarza się na przykład w sposób następujący.

Przykład. W roztworze 23 części wagowych sodu w 300 częściach objętościowych metanolu rozpuszcza się 224 części wagowe kwasu *N* - metylo - C,C - alyloizopropylo - barbiturowego. Przesączony roztwór dopełnia się metanolem do 738 części objętościowych i do ampułek, zawierających po 10 cm³, wprowadza się po 3 cm³ tego roztworu. Z ampułek tych następnie

odparowuje się metanol pod ciśnieniem zmniejszonym (w próżni) bez ogrzewania, aż pozostałość nabierze konsystencji syropu. Przez zanurzenie ampułek do wody podgrzanej do 45°C usuwa się szybko pozostałą resztę metanolu. Wskutek tego zawartość ampułek podnosi się prawie aż do połowy wysokości ampułek i krzepnie. Ampułki wypełnia się powietrzem suchym, pozbawionem dwutlenku węgla, i zatapia je. Każda z nich zawiera 1 g szybko rozpuszczającej się w wodzie soli sodowej kwasu *N* - metylo - C,C - alyloizopropylo - barbiturowego w postaci gotowej do użycia.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób wytwarzania soli sodowej kwasu *N* - metylo - C,C - alylo - izopropylo - barbiturowego w postaci trwałej, suchej i bardzo łatwo rozpuszczającej się w wodzie, znamieny tem, że stężone roztwory alkoholowe soli sodowej kwasu *N* - metylo - C,C - alyloizopropylo - barbiturowego wprowadza się do ampułek, odparowuje w zwykłej temperaturze pod ciśnieniem zmniejszonym do konsystencji syropu i następnie szybko ogrzewa w celu usunięcia pozostałego alkoholu, przyczem zawartość ampułek krzepnie na stałą masę o dużej objętości.

F. Hoffmann - La Roche & Co.
Aktiengesellschaft.
Zastępca: Inż. Cz. Raczynski,
rzecznik patentowy.