

URZĄD PATENTOWY w WARSZAWIE OPIS PATENTOWY

Nr 31905

Kl. 12 q, 29/01

I. G. Farbenindustrie Aktiengesellschaft, Frankfurt n. M. *607d 43/24*

Sposób wytwarzania trwałych preparatów z kwasów o-acylooksybenzenokarbonych i chininy

Zgłoszono 10 marca 1938

Udzielono 10 czerwca 1943

Pierwszeństwo: 11 marca 1938 (Niemcy)

Preparaty z kwasów acylosalicylowych i chininy, albo obojętnych soli chininy, np. chlorowodoru chininy, cytrynianu i tannianu chininy, wytwarzanych częściowo z dodatkiem kwasu cytrynowego, okazały się cenne w lecznictwie. Jednakże tego rodzaju mieszaniny nie są trwałe, rozkładają się one po upływie krótkiego czasu, odszczepiając np. kwas organiczny. Przy tym np. w pewnych warunkach z chininy może powstać chinotoksyna. Rozkład zewnętrznie można poznać po tym, że mieszaniny proszkowate spiekają się, pachną kwasem organicznym, np. octowym, i zwłaszcza w postaci stłaczanej (tabletki) łatwo zmieniają zabarwienie.

Obecnie spostrzeżono niespodziewa-

nie, że z kwasów o-acylooksybenzenokarbonych i chininy można otrzymywać preparaty odpowiadające wszelkim praktycznym wymaganiom, dotyczącym trwałości, jeżeli do wyrobu preparatów zamiast alkaloidu albo jego soli obojętnych zastosować sole dwuchlorowodoru chininy reagujące kwaśno. Tak więc np. okazało się, że preparat z kwasu acylosalicylowego i dwuchlorowodoru chininy po dłuższym przechowaniu w temperaturze 37°C. zewnętrznie nie uległ zmianie, ani też nie zawierał wolnego kwasu octowego, gdy w tych samych warunkach mieszanina z chininą albo z obojętnymi solami chininy po upływie krótkiego czasu wykazy-

wała mocny zapach kwasu octowego i była spieczona w stałą masę.

Jako kwasy *o*-acylooksybenzenokarbonowe stosuje się korzystnie pochodne acylowe kwasu salicylowego, np. kwas acetylosalicylowy. Innymi odpowiednimi kwasami *o*-acylooksybenzenokarbonowymi są np. związki alkylowane w rdzeniu, zwłaszcza takie związki, które zawierają wyższą resztę alkylową, np. kwas izooktyloacetylosalicylowy, dalej związki alkoksylowane, jak kwas metoksyacetylosalicylowy, a także kwasy *o*-acylooksybenzenokarbonowe, zawierające ugrupowanie kwasów *o*-acylooksybenzenokarbonowych powtórzone kilkakrotnie. Jako reszta acylowa jest odpowiednia przede wszystkim reszta acetylowa, a prócz tego również jeszcze inne reszty, jak propionylowa, metoksyacetylowa, furfuroilowa i t. d.

Wytwarzanie nowych preparatów odbywa się np. przez dokładne roztarcie składników albo przez zmieszanie w obojętnym rozpuszczalniku i usunięcie po tym rozpuszczalnika. Celowo stosuje się kwas acylosalicylowy w nadmiarze. Nowe techniczne działanie produktów według wynalazku, polegające na nieoczekiwanej trwałości, należy przypisać chemicznemu działaniu na siebie składników, przy czym

prawdopodobne jest powstawanie związków cząsteczkowych.

Przykład I. 10 części kwasu acetylosalicylowego i 1 część dwuchlorowodoru chininy rozciera się dokładnie. Produkt roztarcia, a także wytworzone z niego z dodatkiem skrobi w zwykły sposób tłoczone tabletki są trwałe.

Przykład II. 1 część dwuchlorowodoru chininy rozprasza się miotłko w 5 częściach benzenu. Do mieszaniny dodaje się roztworu 5 części kwasu izooktyloacetylosalicylowego w 20 częściach benzenu i następnie benzen w niskiej temperaturze usuwa, celowo pod zmniejszonym ciśnieniem. Pozostałość tworzy bezbarwny trwały proszek.

Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób wytwarzania trwałych preparatów z kwasów *o*-acylooksybenzenokarbonowych i chininy, znamienny tym, że stosuje się dwuchlorowodorek chininy.

2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że jako kwas *o*-acylobenzenokarbonowy stosuje się kwas acetylosalicylowy.

I. G. F a r b e n i n d u s t r i e
A k t i e n g e s e l l s c h a f t
Zastępca: M. Skrzypkowski
rzecznik patentowy

