

15 stycznia 1927 r.

C07c, 69786

URZĄD PATENTOWY



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIŚ PATENTOWY

Nr 4378.

Kl. 12 q 29.

Farbenfabriken vorm. Friedr. Bayer & Co.
(Leverkusen, Niemcy).

Sposób otrzymywania kwasu *o*-acetoksy-*p*-metoksy-benzoesowego.

Zgłoszono 1 kwietnia 1925 r.

Udzielono 8 marca 1926 r.

Pierwszeństwo: 4 kwietnia 1924 r. (Niemcy).

Związki o punkcie topności 140° i $145-147^{\circ}$ C opisane są w literaturze (Ber. 24,2852, Soc. 107,1494) jako kwasy *o*-acetoksy-*p*-metoksybenzoesowe.

Związki te, według doświadczeń wynalazczyni, działają pod względem fizjologicznym nierównomiernie. Na podstawie dokonanych badań stwierdzono, że są to zmienne mieszaniny, składające się z nieznanego dotychczas i opisanego poniżej, prawdziwego związku acetylowego i kilku innych, pod względem leczniczym mniej wartościowych ciał, przedewszystkiem zaś z kwasu metoksylacylowego o punkcie topności 160° C.

Obecnie wykryto, że nieznanym dotychczas kwas *o*-acetoksy-*p*-metoksybenzoesowy, o punkcie topności $119^{\circ}-121^{\circ}$ C, w

postaci czystej i o jednostajnym działaniu fizjologicznym otrzymuje się przez ostrożne acetylowanie będącego produktem wyjściowym kwasu metoksylacylowego, jeżeli np. przedsięwziąć środki, aby reakcja przebiegała bez znaczniejszych zmian ciepła.

Otrzymany w ten sposób związek jest dla organizmu znośniejszym, obniża gorączkę i uśmierza ból w stopniu silniejszym, niż sam kwas acetylosalicylowy, nawet wtedy, gdy stosuje się go w dawkach mniejszych od tego ostatniego.

Przykład I. 168 części wagowych kwasu *p*-metoksy-*o*-oksybenzoesowego rozpuszcza się w 300 częściach wag. eteru suchego i gotuje w ciągu $1-1\frac{1}{2}$ dnia, pod chłodnicą zwrotną ze 115 częściami wagowymi bezwodnika kwasu octowego. Po odpędzeniu

eteru otrzymuje się ciecz oleistą, krzepnącą szybko na masę krystaliczną. Po przekryształizowaniu z rozcieńczonego alkoholu tworzą się igiełki, topiące się w temperaturze 119—121°.

Przykład II. 168 części wagowych kwasu *o*-metoksy-*o*-oksybenzoesowego zarabia się 600 częściami wagowymi benzolu w ciągu 2 dni, miesza się w temperaturze 30 — 40° ze 115 częściami wagowymi bezwodnika kwasu octowego. Wykrystalizowuje się związek acetylowy, otrzymany w przykładzie I, który po przekryształizowaniu z benzolu topi się również w temperaturze 119—121°.

Przykład III. 50 części wagowych kwasu *o*-oksy-*p*-metoksybenzoesowego rozpuszcza się ochładzając w 200 częściach wagowych pirydyny. Do roztworu tego, mieszając energicznie i studząc mieszaninę chłodzącą, dodaje się zwolna obliczoną ilość

chlorku acetylu. Po odstaniu się w ciągu 1½ dnia w temperaturze pokojowej roztwór wlewa się do ochłodzonego lodem, rozcieńczonego kwasu siarkowego; tworzy się białe osady, który odsącza się i przemywa kilkakrotnie wodą. Otrzymany produkt, po wysuszeniu w próżni, przekryształizowuje się w benzolu.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób otrzymywania kwasu *o*-acetoksy-*p*-metoksybenzoesowego, znamienny tem, że kwas *p*-metoksy-*o*-oksybenzoesowy poddaje się ostrożnemu acetylowaniu.

Farbenfabriken vorm.
Friedr. Bayer & Co.
Zastępca: M. Skrzypkowski,
rzecznik patentowy.