

20 stycznia 1928 r.

URZĄD PATENTOWY

CO7c 129/12



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIŚ PATENTOWY

Nr 8058.

Kl. 12 o 17.

Chemische Fabrik auf Actien (vorm. E. Schering)
(Berlin, Niemcy).

Sposób otrzymywania symetrycznych dwuaryloguanidyn.

Zgłoszono 16 listopada 1926 r.

Udzielono 25 listopada 1927 r.

Pierwszeństwo: 30 listopada 1925 r. (Niemcy).

Jeżeli arylo-aminy wzięte w nadmiarze poddać działaniu soli izo-tio-moczniko-eterów, to otrzyma się dwu-arylowaną guanidynę. Przytem drugi substytutent nie przyłącza się do atomu azotu, z którym to atomem wiąże się pierwszy, lecz łączy się z drugą pierwszorzędową grupą aminową guanidyny.

Otrzymane w ten sposób związki szczególnie pod postacią ich soli, łatwo rozpuszczalnych w wodzie, posiadają zastosowanie terapeutyczne.

Przykład I. 80 g aniliny ogrzewa się z 72 g bromowodorku S-etylo-izo-tio-mocznika (lub też jodo-wodorku S-metylo-izo-tio-mocznika, lub chlorowodorku S-benzoylo-izo-tio-mocznika i tem podobnych, w odpo-

wiadających stechiometrycznych ilościach). Ogrzewanie prowadzi się w temperaturze 100—130°, w obecności małej ilości wody, tak długo, aż przestanie oddestylowywać merkaptan. Produkt reakcji uwalnia się od nadmiaru aniliny, przez wyekstrahowanie jej eterem; osad alkalizuje się ługiem sodowym. Symetrycznie podstawiona dwufenyl-guanidyna krystalizuje się wtedy pod postacią pryzm, bardzo trudno rozpuszczalnych w wodzie, łatwo natomiast, rozpuszczających się w alkoholu i eterze. Związek ten posiada punkt topnienia 148—149°.

Przykład II. 10,8 g bromowodorku S-etylo-izo-tio-mocznika ogrzewa się w powyżej opisanym sposobie z 9-cioma gramami

o-anizydyny. Powstaje czerwono-brunatna masa, którą uwalnia się od nadmiaru o-anizydyny zapomocą eteru lub benzolu. Otrzymany, symetryczny bromowoderek dwu-(o-metoksy-fenilo)-guanidyny topi się po przekrystalizowaniu z acetonu lub alkoholu przy 195—196°. Z wodnego roztworu, wytrąca się zasadę zapomocą traktowania alkaljami, pod postacią oleju, który po pewnym czasie zestala się. Zasada, tworząca białe, tłuste błyszczące łuski, topniejące przy 120°C, jest bardzo trudno rozpuszczalna w wodzie, łatwo rozpuszcza się natomiast w rozpuszczalnikach organicz-

nych. Przy gotowaniu z alkaljami tworzy odpowiedni mocznik.

Zastrzeżenie patentowe.

1. Sposób otrzymywania symetrycznej dwu-arylo-guanidyny, względnie jej soli, znamienny tem, że arylo-aminy, wzięte w nadmiarze poddaje się działaniu soli izotio-moczniko-eterów.

Chemische Fabrik auf Actien
(vorm. E. Schering).

Zastępca: Inż. Cz. Raczyński,
rzecznik patentowy.