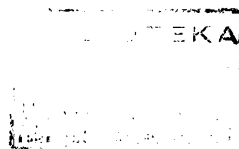


URZĄD PATENTOWY



607d 51/20



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 20167.

Kl. 12 p, 7/01.

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

Sposób otrzymywania kwasu C, C-fenylo-etylo-N-n-propylo-barbiturowego.

Zgłoszono 1 maja 1933 r.

Udzielono 29 maja 1934 r.

Pierwszeństwo: 30 czerwca 1932 r. (Niemcy).

Kwas C, C-fenylo-etylo-barbiturowy stosuje się często przy leczeniu padaczki. Jednakowoż z powodu silnego działania narkotycznego tego środka pożądane stałe jego przyjmowanie w częstych dawkach było niemożliwe. Znany N-metylowy produkt podstawienia tego kwasu, który działa również korzystnie w przypadkach padaczki, wykazuje słabsze działanie narkotyczne.

Z innych związków, oprócz kwasów C, C-fenylo-etylo-barbiturowych, podstawionych przy azocie grupą metylową lub etylową, znany jest jeszcze związek benzylowy. (Journ. of the Americ. chem. Soc. 51, 1929, str. 316).

Stwierdzono obecnie, że otrzymuje się nieznany dotychczas, cenny środek leczniczy, przewyższający działaniem związek metylowy i etylowy, a mianowicie kwas C, C-fenylo-etylo-N-n-propylo-barbiturowy, jeżeli uwodorni się katalitycznie kwas C, C-fenylo-etylo-N-etylo-barbiturowy, który łatwo można otrzymać z kwasu C, C-fenylo-etylo-barbiturowego przez alylowanie w obecności proszku miedzanego.

Kwas C, C-fenylo-etylo-N-n-propylo-barbiturowy jest łatwo rozpuszczalny w alkaliach. Z roztworu alkalicznego daje się wytrącić zapomocą kwasów. Kwas ten rozpuszcza się również łatwo w zwykłe używanych rozpuszczalnikach organicznych,

jak benzenie, alkoholu, eterze, chloroformie i acetonie; tworzy ładne kryształy, które topnieją w 77 — 78°C. Kwas C, C-fenylo-etylo-*N-n*-propylo-barbiturowy, technicznie łatwo dostępny według niniejszego sposobu, działa tak samo korzystnie w przypadkach padaczki, jak i kwas C, C-fenylo-etylo-*N*-metylo-barbiturowy, wprowadzony niedawno do lecznictwa. Związek, otrzymany według wynalazku, posiada również jak i kwas ten istotne zalety przy leczeniu padaczki, ponieważ nie wykazuje zupełnie działania narkotycznego. Różni się od tego kwasu oraz od kwasu C, C-fenylo-etylo-*N*-etylo-barbiturowego bardzo korzystnie tem, że posiada znacznie mniejsze własności trujące, co przy częstem używaniu tego środka leczniczego w ciągu dłuższego czasu ma ważne znaczenie.

Przy stosowaniu doustnem znaleziono np. dla myszy i królika następujące dawki w g na kg zwierzęcia.

	Mysz dawka		Królik dawka	
	nie- szkod- liwa	śmier- telna	nie- szkod- liwa	śmier- telna
kwas C, C-fenylo-etylo- <i>N</i> -metylo-barbiturowy . . .	0,25 g	0,50 g	0,20 g	0,30 g
kwas C, C-fenylo-etylo- <i>N</i> -etylo-barbiturowy	0,15 g	0,25 g	0,30 g	0,40 g
kwas C, C-fenylo-etylo- <i>N-n</i> -propylo-barbiturowy . . .	0,50 g	1,00 g	0,40 g	0,60 g

Z zestawienia tego wyniku wyraźnie wyższość związku propylowego.

Przykład I. 100 części wagowych kwasu C, C-fenylo-etylo-*N*-alylo-barbiturowe-

go rozpuszcza się w 100 częściach wagowych alkoholu metylowego i działa wodorem w obecności 0,1 części wag. chlorku palladowego i 2,5 części wag. węgla odbarwiającego pod zwykłym lub nieco zwiększonym ciśnieniem, mieszając odpowiednio ciecz, przy normalnej temperaturze. Obliczona ilość wodoru zostaje wchłonięta w czasie krótszym od 1 godziny. Z roztworu, oczyszczonego przez filtrowanie od katalizatora, krystalizuje, po dodaniu małej ilości wody, kwas C, C-fenylo-etylo-*N-n*-propylo-barbiturowy w ładnych bezbarwnych kryształach o punkcie topnienia 77—78°C. Uwzględniając małe ilości otrzymanego związku, które pozostają w ługu macierzystym i dają się zwykle łatwo otrzymać, wydajność jest równa teoretycznej.

Przykład II. Do roztworu 100 części wagowych kwasu C, C-fenylo-etylo-*N*-alylo-barbiturowego w 100 częściach wagowych alkoholu etylowego dodaje się 2 części wag. w zwykły sposób otrzymanego katalizatora niklowego i poddaje, mieszając, działaniu wodoru w naczyniu zamkniętem przy 70°C i nadciśnieniu 10 — 15 atm. Uwodornianie zostaje w krótkim czasie zakończone. Produkt reakcji daje się otrzymać z alkoholowego roztworu w sposób, opisany w przykładzie I.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób otrzymywania kwasu C, C-fenylo-etylo-*N-n*-propylo-barbiturowego, znamieny tem, że na kwas C, C-fenylo-etylo-*N*-alylo-barbiturowy działa się wodorem w obecności katalizatora.

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