

Warszawa, 22 czerwca 1935 r.

URZĄD PATENTOWY



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 21550.

Kl. 12 p, 9.

Chemische Fabrik vorm. Sandoz
(Bazylea, Szwajcaria).

Sposób wytwarzania *N*-metylo-benzylo-5,5-fenilo-etylo-hydantoin.

Patent dodatkowy do patentu Nr 20827.

Zgłoszono 4 grudnia 1933 r.

Udzielono 20 maja 1935 r.

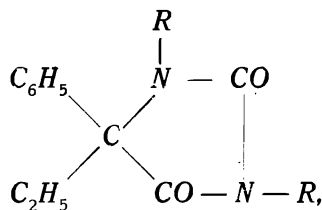
Najdłuższy czas trwania patentu do 11 grudnia 1949 r.

Wynalazek niniejszy dotyczy sposobu wytwarzania *N*-metylo-benzylo-5,5-fenilo-etylo-hydantoin.

Przy dalszem opracowywaniu sposobu, opisanego w patencie Nr 20827, okazało się, że można otrzymywać *N*-metylo-benzylowe pochodne-5,5-fenilo-etylo-hydantoiny przez metylowanie jedno-*N*-benzylo-5,5-fenilo-etylohydantoiny lub przez benzylowanie jedno-*N*-metylowych pochodnych 5,5-fenilo-etylo-hydantoiny. W ten sposób można wytwarzać *N,N*-metylo-benzylo-5,5-fenilo-etylo-hydantoiny.

Te same połączenia można wytwarzać, stosując zamiast związków 5,5-fenilo-etylo-

hydantoiny odpowiednie pochodne 5-fenilo-hydantoiny, ponieważ grupę etylową można łatwo wprowadzić w położenie 5 do metylo-benzylo-5-fenilo-hydantoiny. Związki, otrzymywane w powyższy sposób, mają następujący wzór ogólny:



w którym jedna litera *R* oznacza grupę benzylową albo podstawioną grupę benzy-

lową, druga zaś litera R oznacza grupę metylową.

W celu wytworzenia tych związków jedno-metylowane albo jedno-benzylowane hydantoiny poddaje się benzylowaniu lub metylowaniu, korzystnie w obecności rozpuszczalnika lub rozcieńczalnika albo ich mieszaniny oraz w obecności substancji, które działają jako czynniki, wiążące kwasy.

Jako czynniki metylujące lub benzylujące można stosować takie związki, jak chlorek metylu, siarczan dwumetylu, chlorek benzylu, chlorek nitrobenzylu.

Związki, otrzymywane według wynalazku niniejszego, są bezbarwne, krystaliczne, bez smaku i zapachu. Są one rozpuszczalne w etanolu, metanolu, acetonie, chloroformie, octanie etylu, pirydynie, lodowatym kwasie octowym, lecz prawie nie rozpuszczają się w wodzie. Wykazują małą toksyczność i można je stosować do celów leczniczych.

Następujące przykłady służą do wyjaśnienia wynalazku, nie ograniczając jego zakresu.

Według wzoru: $C_{19}H_{20}O_2N_2$

obliczono: 9,09% N.

znaleziono: 9,22% N.

Przykład II. 14,7 części wagowych 1-benzyl-5,5-fenylo-etylo-hydantoiny (otrzymanej przez potraktowanie kwasem fenilo-etylo-benzyl-ureido-eceto-nitrylu) rozpuszcza się w 70 częściach wagowych wody i 6,5 częściach wagowych 40%-owego ługu sodowego i, mieszając w temperaturze 60°C, zadaje się 6,6 częściami wagowymi siarczanu dwumetylu. Produkt reakcji wytrąca się przytem najpierw w postaci substancji olejistej, szybko krzepnącej. Po oddzieleniu strąconego osadu i przekrystalizowaniu go

Przykład I. 14,7 części wagowych 3-benzyl-5,5-fenyloetylohydantoiny (wytworzonej przez bezpośrednie benzylowanie 5,5-fenylo-etylo-hydantoiny) rozpuszcza się w 75 częściach wagowych gorącego etanolu, dodaje 14 części wagowych 40%-owego roztworu wodorotlenku sodowego i na otrzymany roztwór działa się ostrożnie w temperaturze 55 — 75°C, dobrze mieszając, 13 częściami wagowymi siarczanu dwumetylu. Podczas ostygnięcia mieszaniny reakcyjnej strąca się 1-metylo-3-benzyl-5,5-fenylo-etylo-hydantoina w postaci cienkich igieł; strącenie to można uzupełnić przez dodanie wody. Wytworzony związek krystalizuje z rozcieńczonego etanolu w postaci dużych kryształów o punkcie topnienia 83 — 85°C. Jest on łatwo rozpuszczalny w etanolu, metanolu, chloroformie lub lodowatym kwasie octowym; trudniej w eterze i eterze naftowym, nie rozpuszcza się w wodzie i w roztworze wodorotlenku sodowego.

Do zanalizowania 0,2547 g substancji zużywa się (według Kjeldahl'a) 16,77 cm³ 0,1 n . H₂SO₄.

z etanolu otrzymuje się 1-benzyl-3-metylo-5,5-fenylo-etylo-hydantoinę w postaci bezbarwnych kryształów o punkcie topnienia 120 — 121°C. Otrzymany związek jest łatwo rozpuszczalny w etanolu, metanolu, chloroformie lub lodowatym kwasie octowym, trudniej w eterze lub eterze naftowym, nie rozpuszcza się w wodzie i ługu sodowym.

Do zanalizowania 0,2960 g substancji zużywa się (według Kjeldahl'a) 19,41 cm³ 0,1 n . H₂SO₄.

Według wzoru: $C_{19}H_{20}O_2N_2$

obliczono: 9,19% N.

znaleziono: 9,09% N.

Stosując zamiast pochodnych benzylo- wych odpowiednie pochodne metylowe i działając na nie chlorkiem benzylu, można otrzymywać związki, identyczne z powyższymi.

Zastrzeżenia patentowe.

Sposób wytwarzania *N*-metylo-benzylo-5,5-fenilo-etylohydantoin według patentu Nr 20827, znamieny tem, że na jedno-*N*-metylo- lub na -*N*-benzylo-5,5-fenilo-etylohydantoiny działa się czynnikami benzylującymi względnie metylującymi.

2. Odmiana sposobu według zastrz. 1, znamienna tem, że na *N*-metylowe względnie *N*-benzylowe pochodne 5-fenilohydantoiny działa się najpierw środkami benzylu-

jącymi względnie metylującymi, a następnie otrzymany związek poddaje się działaniu środka etylującego w celu wprowadzenia grupy etylowej w położenie 5.

3. Sposób według zastrz. 1 — 2, znamieny tem, że reakcję prowadzi się w obecności rozpuszczalnika lub rozcieńczalnika albo w obecności ich mieszaniny.

4. Sposób według zastrz. 2, znamieny tem, że reakcję prowadzi się w obecności substancyj, działających jako czynniki, wiążące kwasy.

Chemische Fabrik
vorm. Sandoz.

Zastępca: Inż. dypl. M. Zoch,
rzecznik patentowy.