

KRALJEVINA JUGOSLAVIJA

UPRAVA ZA ZAŠTITU



INDUSTRIJSKE SVOJINE

KLASA 12 (5).

IZDAN 1 JANUARA 1936

PATENTNI SPIS BR. 11958

Knoll A. G. Chemische Fabriken, Ludwigshafen a. Rhein, Nemačka.

Postupak za izradu preparata 6 - metilamino - 2-metil-2-heptena,
lako rastvorljivih u vodi.

Prijava od 26 februara 1935.

Važi od 1 maja 1935.

Traženo pravo prvenstva od 27 aprila 1934 (Nemačka).

Pronađeno je, da 6-metilamino-2-metil-2-hepten u obliku svojih soli ima tu pomena vrednu osobinu, da u ogromnoj meri pojačava rastvorljivost u vodi 4-dimetilamino-1-fenil-2,3-dimetil-piracolonu, pri čemu se dobivaju na lak način jako koncentrisani i trajni rastvori, koji se niti u hladnoći, niti pri razređivanju, ne razlažu u komponente.

Za ovo se mogu upotrebiti proizvoljne soli ili sona jedinjenja baze, pri čemu je bez značaja za njihovo dejstvo pojačavanja rastvorljivosti, da li su sama lako rastvorljiva u vodi. I teško rastvorljive soli pokazuju to dejstvo pojačavanja rastvorljivosti, pri čemu i one same postaju lako rastvorljive u vodi. Na pr. pri upotrebi slabo rastvorljive soli cimetne kiseline metilamino metilheptena može se napraviti jedan bar 45% -ni rastvor komponenata. So hlorovodonične kiseline te baze daje skoro 65% -ne rastvore. Takođe pojačavaju rastvorljivost dimetilaminofenildimetilpiracolonu soli metilaminometilheptena sa barbiturskom kiselinom ili njenim derivatima, pri čemu se na pr. pomoću soli dietilbarbiturske kiseline mogu napraviti sa lakoćom čak i 70% -ni rastvori.

Dalje je pronađeno, da pojačavanje rastvorljivosti utiče na stehiometričke količine teško rastvorljivih komponenata, iz čega se može sa sigurnošću zaključiti da se pri tome stvaraju jedinjenja. So cimetne kiseline te baze jedini se sa dimetilaminofenildimetil-

piracolonom u odnosu 1:1. Isti rezultat se postiže pri upotrebi kisele soli vinske kiseline. Nasuprot tome jedini se neutralna so vinske kiseline, ili hlorhidrat baze u odnosu 3:1, dok se so dietilbarbiturske kiseline jedini sa dimetilaminofenildimetilpiracolonom u odnosu 3:2.

Usled njihove rastvorljivosti u vidu ovi novi preparati su terapijski dragoceni. Oni se mogu upotrebljavati kako u vodenom rastvoru, tako i u obliku tableta.

Kao što je poznato ima metilamino-metilhepten dragocena spazmolitička svojstva. Dalje je poznato, da ima to preimućstvo, da može da spoji dejstvo otklanjanja grčeva nekog leka sa dejstvom ublažavanja bolova. Usled toga dobivaju nova jedinjenja utoliko znatan terapijski značaj, što imaju preimućstva jednog i parantalno upotrebljivog leka sa osobenim spazmolitičkim i istovremeno analgetskim dejstvom.

Primeri:

1) U 100 gr. jednog 50% -nog rastvora hlorovodoničnog metilaminometilheptena rastvori se 21.5 gr. dimetilaminofenildimetilpiracolonu uz lako zagrevanje. Dobija se bistar skoro 60% -ni rastvor jedinjenja hlorovodoničnog metilaminometilheptena sa dimetilaminofenildimetilpiracolonom u stehiome-

riskom odnosu 3:1. Čak i u hladnoći ne talože se kristali iz rastvora.

2) 20 gr. kiselog metilaminometilhepten-tartrata dobro se izmeša sa 16 gr. dimetilaminofenildimetilpiracolona. Mešavina se bistro rastvara u vodi do 45% -ne koncentracije novog jedinjenja. Stehiometrički odnos obeju komponenata iznosi 1:1.

3) 14. 1 gr. metilaminometilheptena, 14. 8 gr. cimetne kiseline i 23. 1 gr. dimetilaminofenildimetilpiracolona mučka se sa 63 gr. vode, eventualno uz zagrevanje, do potpunog rastvaranja. Bistar skoro bezbojan rastvor sadrži 45% jedinjenja cimetno kiselog metilaminometilheptena sa dimetilaminofenildimetilpiracolonom u stehiometričkom odnosu 1:1.

Rastvorljivost cimetno kiselog metilaminometilheptena iznosi samo 3. 8%.

4) 19. 3 gr. metilaminometilhepten dietilbarbiturske kiseline zagreva se sa 9. 2 gr. dimetilaminofenildimetilpiracolona do stvaranja bistre istopine, preimućstveno u zatvorenom sudu bez vazduha. Zatim se rashlađuje mešajući.

Jedinjenje metilaminometilheptena dietilbarbiturske kiseline i dimetilaminofenildimetilpiracolona ima stehiometrički odnos 3:2, lako je rastvorljivo u vodi, ima tačku tečenja na 56°, a tačku topljenja na 86°. Jedinjenje se može bistro rastvarati u vodi do koncentracije od 70%.

Patentni zahtevi:

1) Postupak za izradu u vodi lako rastvorljivih preparata 6-metilamino-2-metil-2-heptena, naznačen time, što se obrađuju preimućstveno u prisustvu vode soli ili sona jedinjenja 6 metilamino-2-metil-heptena sa 4 dimetilamino-1-fenil-2, 3—dimetil-5-piracolonom.

2) Postupak prema zahtevu 1, naznačen time, što se mesto gotovih soli 6-metilamino-2-metil-2-heptena upotrebljavaju odgovarajući sastavni delovi, t. j. baza i kiselina u željenom odnosu, pre ili za vreme obrade sa 4-dimetilamino-1-fenil-2, 3-dimetil-5-piracolonom.