

1 8 9 8 4 2

PATENTE DE INVENCION

=====

REF. 142.612

=====



189 842

M E M O R I A D E S C R I P T I V A

SOBRE:

"PROCEDIMIENTO PARA LA FABRICACION DE COMPUESTOS
SUBSTITUIDOS DERIVADOS DEL NAFTALENO".

SOLICITANTES: N. V. ORGANON, residentes en :
Kloosterstraat 6, OSS, Holanda.

Este invento se refiere a un procedimiento para la fabricación de compuestos substituidos, derivados del naftaleno.

- En la Solicitud pendiente N° 189.829, se describe una síntesis "diénica" de benzoquinona y buta-1.3-dieno, substituido en la posición 2. Por este procedimiento se obtienen compuestos substituidos en la posición β del nucleo bisubstituido (I) (los números romanos se refieren al dibujo adjunto. Este invento se refiere a las condiciones en las que esta síntesis diénica
- 5.
- 10.

189842² -



24 SEP 5

se realiza con éxito en los casos en que se desee preparar compuestos α -sustituídos (II).

15. Este invento se describirá con referencia a la preparación de 1.4-diketo-5-metil-naftaleno (V). (La posición 5 es idéntica a la posición α), pero desde luego no se limita a estos substituyentes, sino que pueden aplicarse para la preparación de todos los compuestos α -sustituídos-1.4-bisubstituídos.

20. B.A. Arbussow y S.M. Spekterma (Trans.Kirov's Inst. Chem. Technol. Kazan 8, 21 (1840); C. 1942 I, 481) describieron la condensación del piperileno (III) y la benzoquinona (IV). Realizaron la condensación en nitrobenzeno y calentando a presión durante 6 horas a 130-140° C. Obtuvieron un producto, con muy poco rendimiento, que probablemente no contenía trazas de V. Se ha
25. descubierto, con sorpresa, que esta condensación se verifica suavemente y con buen rendimiento cuando se calienta durante 1 a 1-1/2 horas en ácido acético glacial, a 50° C aproximadamente. Precisamente después de la
30. formación de Arbussow, antes indicada, no podía preverse que esta síntesis diénica se realizara de modo tan excelente en estas condiciones tan suaves. La importancia de estos compuestos se debe al lugar que ocupan en la síntesis completa de los esteroides.

35. EJEMPLO - Preparación de 1.4-diketo-5-metil-1.4.5.8.9.10-hexahidronaftaleno.- En 2 c.c. de ácido acético glacial, con una gota de anilina, se calientan durante 1-1/2 horas a 50° C, 2 g. de piperileno puro (punto de fusión 41-43° C) (compárese F.G. Fischer y K. Löwenberg, Ber. 66, 669
40. (1933)). Después de verter en agua y de separar el pre-

189842

24 SEP 5



cipitado por filtración, éste se disuelve en éter y se seca con sulfato sódico. El éter se destila, y se obtiene un aceite viscoso que se destila en vacío (0.02 mm. y 111-116°C) y después de algunos días el aceite

45. se solidifica; rendimiento 1,4 g. Después de recristalización en éter-éter de petróleo y de sublimación a 100°C y 0,02 mm., el punto de fusión es 146-147°C.

- N O T A -

Habiendo ya descrito ampliamente la naturaleza

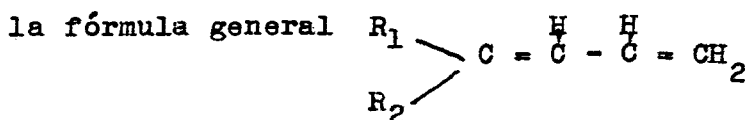
50. del invento, así como la manera de llevarlo a cabo en la práctica, se hace constar que el procedimiento anteriormente descrito es susceptible de ligeras modificaciones de detalle, sin que por ello se altere el principio fundamental del invento. También se hace constar

55. que dicho invento se refiere a una Patente presentada en Holanda, con fecha 2 de Octubre de 1948 bajo el número 142.612, acogiéndose por lo tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del invento y por lo que se

60. solicita Patente de Invención por veinte años en España: "Procedimiento para la fabricación de compuestos substituídos derivados del naftaleno"; caracterizándose por lo siguiente:

1º - Procedimiento para la fabricación de

65. compuestos substituídos derivados del naftaleno, caracterizado por llevarse a cabo mediante la condensación de la benzoquinona con un cuerpo diénico o alénico, y porque la benzoquinona se condensa con un compuesto de



70.

189842

24 SEP. 1949



en la que R_1 y R_2 son grupos monovalentes, uno de los cuales puede incluso representar hidrógeno.

75. 2º - Procedimiento, según lo especificado en la reivindicación 1, caracterizado por destinarse a la fabricación de 1.4-diketo-5-metil-1.4.5.8.9.10-hexahidronaftaleno y porque la síntesis diénica descrita se realiza con benzoquinona y piperileno.

80. 3º - Procedimiento para la fabricación de compuestos substituídos derivados del naftaleno, caracterizado por obtenerse 1.4-diketo-5-alcohol-1.4.5.8.9.10-hexahidro-naftaleno.

85. 4º - Procedimiento para la fabricación de compuestos substituídos derivados del naftaleno, caracterizado por obtenerse 1.4-diketo-5-metil-1.4.5.8.9.10-hexahidro-naftaleno.

90. 5º - Procedimiento para la fabricación de compuestos substituídos derivados del naftaleno; tal y como queda descrito en la presente Memoria y representado en el dibujo que se acompaña.

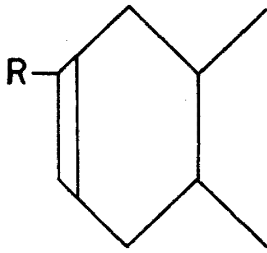
Esta Memoria consta de cuatro hojas escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, 24 de Septiembre de 1949.

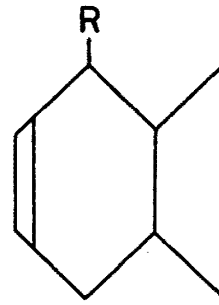
N. V. ORGANON,

Por Pedro J. J. J.

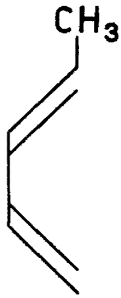
I



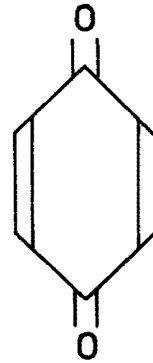
II



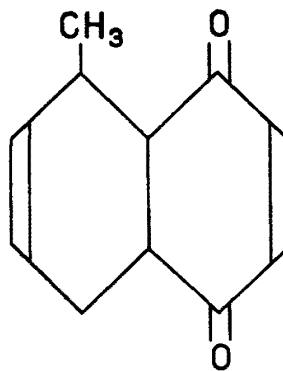
III



IV



V



Madrid, 24 de septiembre de 1949.