



1 JUN

209588

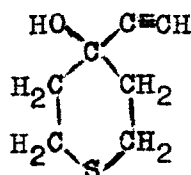
P A T E N T E
D E
I N V E N C I O N

209588

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN COMPUESTO DE TIAPIRANO", a favor de la razón social suiza "Hoffmann-La Roche & Cfe., S.A., domiciliada en Basilea (Suiza).

MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a un procedimiento para la preparación de un nuevo compuesto químico, el 4-etinil-tetrahidrotiapiiran-4-ol. El nuevo compuesto que puede presentarse por la formula



5. es util como sedante y como hipnótico. Puede ser preparado haciendo reaccionar una acetilida de metal alcalino con tetrahidro-1,4-tiapiirona y descomponiendo el complejo metálico así obtenido. El método preferido consiste en hacer reaccionar acetilida de litio con tetrahidro-1,4-tiapiirona, e hidroliza divulgada.
10. La invención es divulgada más ampliamente en el siguiente ejemplo que es ilustrativo, pero no limitativo de la misma.



EJEMPLO

209588

6 g. de litio metal son disueltos en 1,4 litros de amoníaco líquido. Se hace pasar una corriente rápida de acetileno por la solución, hasta que queda decolorada, seguida por una lenta corriente durante dos horas adicionales. Seguidamente se adiciona a la solución de acetilida de litio, agitada durante un período de 15 minutos, una solución de 60 g. de tetrahidro-1,4-tiapirona en 400 moles de éter seco. Se adicionan otros 300 moles de éter y se agita la mezcla durante la noche, mientras se evapora el amoníaco.

La solución de eter remanente es tratada cuidadosamente con hielo y agua, la capa de éter es lavada con agua y secada sobre sulfato sódico anhidrico. Después de separado el disolvente, se destila el residuo en el vacío. La fracción principal presenta un punto de ebullición de 105°-110° a 10mm., solidificándose al estar en reposo. Por recristalización de éter de petróleo ligero resultan cristales blancos de 4-etinil-tetrahidro-tiapiron-4-ol, de punto de fusión 85°-87° C.

La invención dentro de su esencialidad puede ser desarrollada en otras variantes que difieran en detalle de las indicadas a título de ejemplo y a las cuales alcanzará igualmente la protección que se recabó. Podrá, pues, ser llevada a cabo con los medios y aparatos más adecuados por quedar todo ello comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.



N O T A

203588

5. Descrito el invento se hace constar que la presente patente se acoge a los derechos de prioridad de la solicitud de patente Norteamericana Serial nº 293.211 depositada el día 12 de Junio de 1952, y se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones:

10. 1ª.- Procedimiento para la preparación de un compuesto de tiapirano, que consiste en hacer reaccionar una acetilida de metal alcalino con tetrahidro-1,4-tiapirona, e hidrolizar el complejo metálico, formado para producir 4-etiniltetrahidrotiapiran-4-ol.

2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizada porque como material de partida se utiliza acetilida de litio.

15. 3ª.- Procedimiento para la preparación de un compuesto de tiapirano.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de 3 hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 1 de Junio de 1953

F. HOFFMANN-LA ROCHE & Cía., S.A.

p.a.

