

AÑO

Expediente núm.

239182



239182

REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

CERTIFICADO DE ADICION

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de

un **CERTIFICADO DE ADICION** en España,

a favor de

SANDOZ, A.G. entidad suiza., de nacionalidad

domiciliado en Basilea, Suiza.

calle de núm.

por:

«Mejoras

presentada en el objeto de la patente principal núm. 234.575
que fué ~~concedida~~ en 29 de marzo de 1957 por

«Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de
pirazolon".

Nº 430

Agente Sr. Gómez-Acebo y Modet.

239 182

SEGUNDO CERTIFICADO DE ADICION

239 182 Ga 26/I. 17 DIC



MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

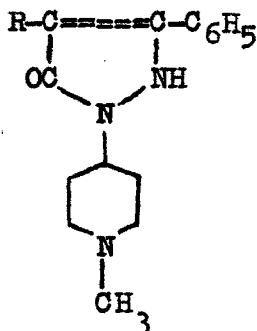
"Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal nº 234.575, presentada en 29 de marzo de 1957, sobre: "Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de pirazonon".

=====

Solicitante : SANDOZ, A.G., entidad suiza, residente en Basilea, Suiza.

=====

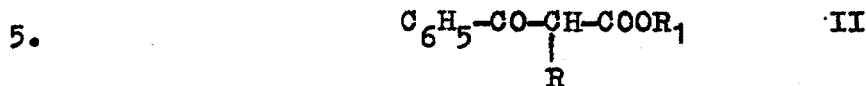
Se ha descubierto que se pueden obtener nuevos derivados de pirazonon de la fórmula I





239182

donde R significa prop-2-inilo bencilo, reaccionando N-metilo-piperidilo-4-hidracina con compuestos ácido benzoilacéticos de la fórmula II



donde R posee el significado arriba indicado y R₁ está por hidrógeno o metilo.

10. EJEMPLO 1.

1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-(prop-2-inilo)-pirazolona-5.

15. A temperatura de ambiente se mezclan 4,0 g de ácido α -(prop-2-inilo)-benzoil-acético en 8 cm³ de cloroformo absoluto con 2,6 g de N-metilo-piperidilo-4-hidracina y la mezcla se calienta en el plazo de 30 minutos a 80°. A continuación se sigue calentando la mezcla de reacción durante 2 horas a 110°, y seguidamente se mantiene a esta temperatura durante 30 minutos en vacío (12 mm Hg). La masa de reacción dura, marrón, oscuro, se disuelve a continuación en caliente en etanol y se enfria lentamente con lo que se separa en forma cristalina la 1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-(prop-2-inilo)-pirazolona-5. Después de volver a recrystalizar de etanol funde el derivado de pirazolona a 134-136° (descomposición).

25. EJEMPLO 2.

1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-bencilo-pirazolona-5.

2,5 g de ácido α -bencilo-benzoilacético en 4 cm³ de cloroformo absoluto y 1,3 g de N-metilo-piperidilo-4-

239182



hidracina se calientan en un recipiente de reacción abierto en el plazo de 30 minutos a 110°, después de calentar durante 3 horas a 130° y a continuación se mantiene a esta temperatura durante 30 minutos en vacío a 12 mm Hg.

5. Después de enfriar se frota la masa de reacción con éter, se filtra y la 1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-bencilo-pirazolona-5 se recristaliza en etanol. Punto de fusión 181-183° (descomposición) de etanol.

EJEMPLO 3.

10. 1-(n-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-bencilo-pirazolona-5.

2,7 g de éster metílico de ácido α -bencilo-benzoilacético y 1,3 g de N-metilo-piperidilo-4-hidracina se calientan en dos horas a 100° y 3 horas a 135° con lo que empieza a cristalizar el producto de reacción la

15. 1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-fenilo-4-bencilo-pirazolona-5 en forma cristalina. Para terminar la reacción y retirar completamente el etanol formado se calienta a continuación 30 minutos en vacío (12 mm Hg) a 125°. Después de enfriar la masa de reacción con éter, se filtra y el derivado de
20. pirazolona se recristaliza de etanol. Punto de fusión 181-183° (descomposición) de etanol.

N O T A

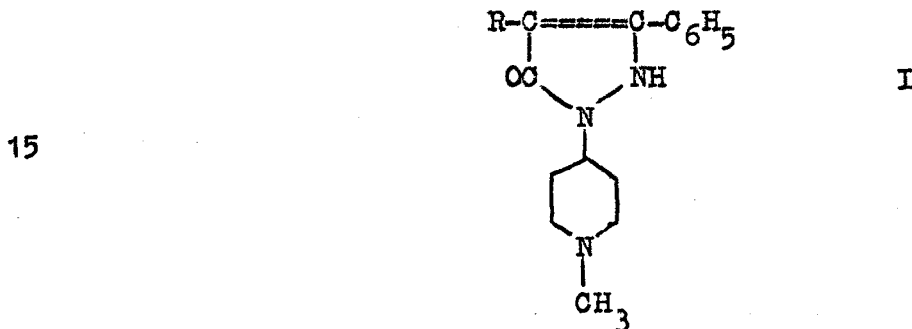
25. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente
30. indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una Adición suiza presentada el 1 de noviembre de 1957 bajo el nº 52178, acogiendo por lo tanto a los beneficios que



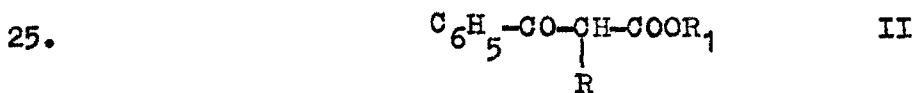
239182

5. conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Segundo Certificado de Adición en España por: "Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal nº 234.575, presentada en 29 de marzo de 1957, sobre: "Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de pirazon"; caracterizándose dichas mejoras por lo siguiente:

10. 12.- Mejoras en el objeto de la patente principal por procedimiento para la obtención de nuevos derivados de pirazon de la fórmula I



20. donde R significa prop-2-inilo o bencilo, caracterizándose dichas mejoras porque N-metilo-piperidilo-4-hidracina se reaccionan con compuestos ácido benzoilacéticos de la fórmula general II



donde R tiene el significado arriba indicado y R₁ significa hidrógeno o metilo.

17 D



239182

2ª.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal Nº 234.575, presentada en 29 de marzo de 1957, sobre: "Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de pirazolon"; tal y como queda sustancialmente descrito en la presente memoria que consta de cinco hojas escritas a máquina por una sola cara.

5.

Madrid,

17 DIC. 1957

SANDOZ, A.G.,

J. GOMEZ ACEBO Y MOJET
A.P.