

AÑO

Expediente núm.



240274

REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

3er 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 introducidas

», en el objeto de la patente principal núm. 234.575,

que fué concedida en 30 de abril de 1957 por

« Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de

pirazolon".

TERCER CERTIFICADO DE ADICION

CASE 796/K.

24027A



240274

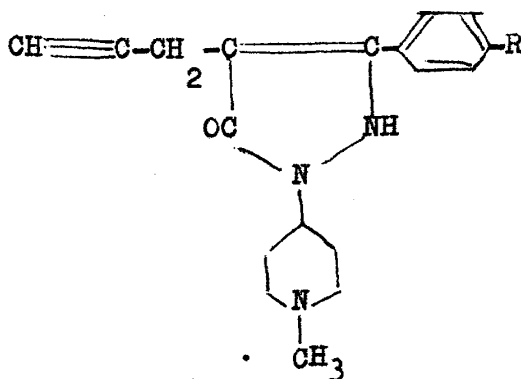
MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

"Mejoras introducidas en el objeto de la patente
"principal nº 234575, concedida en 30 de abril de
"1957, por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS
"DERIVADOS DE PIRAZOLON".

SOLICITANTES: S A N D O Z A.G. entidad suiza, domiciliada en
BASILEA, Suzia.

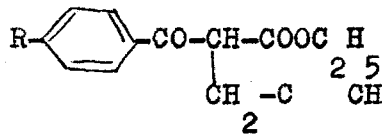
Se ha descubierto que se pueden lograr
nuevos derivados pirazolónicos de la fórmula I





donde R significa cloro o metilo, si N-metilo-piperidilo-4-hidracina se reacciona con ésteres de ácido cetocarbónico de la fórmula II

5.



II

donde R tiene el significado arriba señalado.

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

10.

2,6 g. de N-metilo-piperidilo-4-hidracina y 5,3 g. de éster etílico de ácido α-(prop-2'-inilo)-(p-clorobenzoil)-acético se reúnen y se dejan reposar durante 1/2 hora a temperatura ambiente. Después se calienta durante 1 hora a 80°, 3 horas a 100° y a

15.

continuación 1/2 hora en vacío a 12 mm.Hg. a 110°. La mezcla de reacción marron oscura se frota entonces con éter, se filtra y el residuo de filtración, el derivado pirazolónico, se cristaliza de etanol. Después de

20.

recristalizar 2 veces de etanol, la 1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-(p-clorofenilo-4-(prop-2'-inilo)-pirazolona-5 funde a 265-267° (descomposición).

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

25.

2,6 g. de N-metilo-piperidilo-4-hidracina y 4,9 g. de éster etílico de ácido -(prop-2'-inilo)-(p-tolulo)-acético se reúnen y se deja reposar durante 1/2 hora a temperatura ambiente. Después se calienta una hora a 80°, 3 horas a 100° y a continuación aún 1/2 hora en vacío a 12 mm.Hg. a 110°. La mezcla de reacción marron oscura

30.

se frota entonces con éter, se filtra y el residuo de



filtración, el derivado pirazolónico, se cristaliza de benzol/petroléter. Después de recrystalizar dos veces de benzol/petroléter funde la 1-(N-metilo-piperidilo-4')-3-(p-tolilo)-4-(prop.2'-inilo)pirazolona-5 a 131-134° (descomposición).

5.

N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no alteren su principio fundamental.

10.

Tambien se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de patente presentada en Suiza con fecha 31 de enero de 1958 nº 55319, acogiéndose, por lo

15.

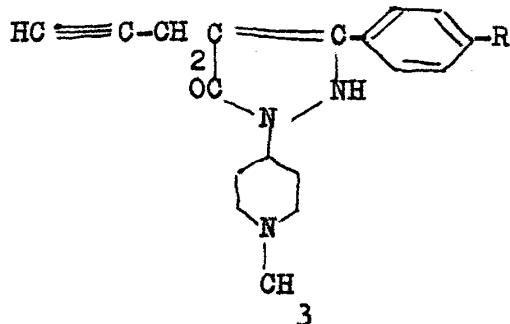
tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor y siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Tercer Certificado de Adición en España: "Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal

20.

nº 234.575 concedida en 30 de abril de 1957, por: "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS "DE PIRAZOLON"; caracterizándose dichas mejoras por lo siguiente:

25.

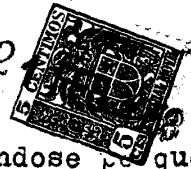
1º.- Mejoras en el procedimiento para la obtención de nuevos derivados de pirazolón, objeto de la patente principal, de la fórmula



I

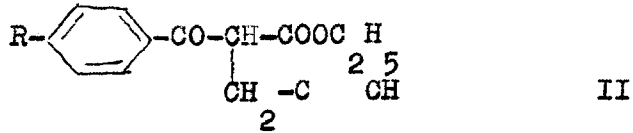
30.

- 4 - 24 274 2



donde R significa cloro o metilo, caracterizándose por que N-metilo-piperidilo-4-hidracina se reacciona con ésteres de ácido cetocarbónico de la fórmula

5.



donde R tiene el significado arriba señalado.

10.

2º.- Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal nº 234.575 concedida en 30 de Abril de 1957, por PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS DE PIRAZOLON; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria, que consta de cuatro hojas, escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

21 FEB. 1958

S A N D O Z A.G.

J. GÓMEZ ACEBO Y MODET

P. R.

