



253408

Memoria Descriptiva

para

una patente de INVENCION, por veinte años,

a favor de

L e p e t i t S.p.A.

-sociedad italiana-

residente en

Milano (Italia)

Via Roberto Lepetit, 10

por:

-Procedimiento para la preparación de un nuevo
analéptico.-

PRICRIDAD

Sol. pte. E.E.U.U. Serial No. 818.508 del día 8 junio 1959.

INVENTOR

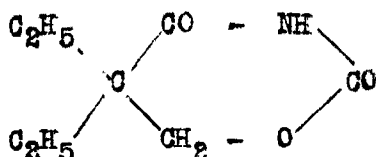
Don Emilio Testa - italiano.



252402

El presente invento se refiere a un procedimiento para la preparaci3n de un nuevo compuesto qu3mico. M3s particularmente el compuesto a que se refiere el invento es la 5,5-di3til-tetrahidro-1,3-oxazina-2,4-diona de la f3rmula

5



10

Este compuesto posee una actividad que supera a la de los compuestos anal3pticos m3s conocidos. Puede administrarse en forma de ampollas, gotas o tabletas en dosis unitarias tan bajas como 1-5 mg., aunque son tambi3n tolerables dosis de 50 a 250 mg. La dosis que se ha de administrar var3a naturalmente seg3n la gravedad del caso.

15

Hasta 1000 mg se ha descubierto que todav3a son seguras y carecen de defectos secundarios desagradables. El compuesto del invento se prepara haciendo borbotar 3cido clorh3drico dentro de una disoluci3n de una mol3cula (y con preferencia menos de dos mol3culas) de un cianato de metal alcalino en un disolvente inerte inmiscible con agua a 0-5° C, hirviendo con reflujo el 3cido α, α -di3til-β-carbamiloxypropionico obtenido con un exceso de cloruro de tionilo, evaporando el exceso de cloruro de tionilo y poniendo en contacto el cloruro residual durante 30 a 60 minutos con piridina anhidra a una temperatura no superior a 45° C. La mezcla se echa sobre agua de hielo y se acidifica con un 3cido mineral en3rgico. El pro-

25



259400

dueto precipitado puede recristalizarse en un disolvente adecuado.

El siguiente ejemplo ilustrará el invento.

Ejemplo:

5 5,5-dietil-tetrahydro-1,3-oxazina-2,4-diona.

Dentro de una mezcla de 117,5 g de ácido α, α -diethyl- β -hidroxi-propiónico, 90 g de cianato sódico y 2000 ml de cloroformo anhidro se hace borbotar ácido clorhídrico durante 2 horas a 0-5° C. Después de agregar 45 g de cianato sódico se continúa el borboteo durante otras dos horas a 0-5° C. La porción sólida se recoge por aspiración, se suspende en agua y se extrae con éter etílico. El disolvente se elimina al vacío y el residuo se recristaliza en agua. Rendimiento, 95 g (62 %) de ácido α, α -diethyl- β -carbamiloxipropiónico con punto de fusión 133° C.

15 Setenta gramos del éster anterior se calientan durante 1 hora a 80-90° C con 120 ml de cloruro de tionilo. El disolvente en exceso se elimina totalmente al vacío y el residuo se trata durante 45 minutos con 200 ml de piridina a 40°. La mezcla se echa sobre 500 ml de agua, se acidifica al rojo congo con ácido clorhídrico y se extrae con éter etílico. Se elimina el disolvente y el residuo se recristaliza en ligroina. Rendimiento, 42 g (66 %); punto fusión 97 - 98° C.



258400

N O T A

Este registro consta de las siguientes reivindicaciones:

5 1a.- Procedimiento para la preparación de un nuevo analéptico y en especial de la 5,5-dietil-tetrahydro-1,3-oxazina-2,4-diona, caracterizado porque consiste en hacer borbotar ácido clorhídrico dentro de una disolución de una molécula de ácido α, α -dietil- β -hidroxipropiónico y un exceso, superior a una molécula, de cianato de metal alcalino en un
10 disolvente inerte inmiscible con agua a 0-5° C, en hervir con reflujo el ácido α, α -dietil- β -carbamiloxipropiónico obtenido con un exceso de cloruro de tionilo, en evaporar el exceso de cloruro de tionilo y en poner en contacto durante 30 - 60 minutos el cloruro residual de α, α -dietil- β -carbamiloxipropióni-
15 lo con piridina anhidra a una temperatura no superior a 45° C.

 2a.- Procedimiento según lo reivindicado en el punto 1, caracterizado porque el cianato de metal alcalino es cianato sódico.

20 3a.- Procedimiento según lo reivindicado en el punto 1, caracterizado porque el disolvente inerte inmiscible con agua es cloroformo anhidro.

 4a.- Procedimiento para la preparación de un nuevo analéptico.

25 Según se describe y reivindica en esta memoria descriptiva.



253408

La cual consta de 5 hojas, foliadas y es -
critas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 14-NOV. 1959

A handwritten signature in cursive script.

Bat.-