



258418

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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS DEL IMINODIBENCILLO", a favor de la firma suiza J. R. GEIGY A.G., domiciliada en BASILEA (Suiza).

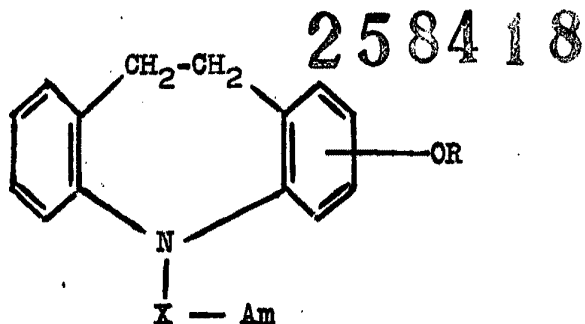
= * =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de nuevos derivados del iminodibencillo.

Más concretamente la invención se refiere a la preparación de nuevos compuestos N-heterocíclicos con valiosas propiedades farmacológicas, así como a los productos intermedios pertinentes.

Se ha encontrado que se puede preparar compuestos con valiosas propiedades farmacológicas, los cuales corresponden a la fórmula general I



I

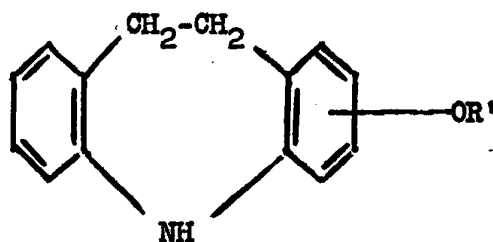
en la que significan

R hidrógeno, un radical alkilo de bajo peso molecular, o un radical aralkilo,

X un radical alquilenos de cadena recta, o ramificado, con 2 - 6 átomos de carbono, y

Am un grupo alkilamino o dialkilamino de bajo peso molecular, a cuyo efecto uno de ambos radicales alkilo de un grupo dialkilamino Am puede estar enlazado directamente con el radical alquilenos X, o ambos radicales alkilo entre sí, directamente o por un átomo de oxígeno, un grupo alkilimino, hidroxialkilimino, o alcanoiloxialkilimino inferiores, de la manera siguiente:

Se transpone un compuesto de fórmula general



II

15. en la que significa

R' un radical alkilo de bajo peso molecular, un radical aralkilo, un radical alfa-alcoxialkilo, o el radical tetrahidropiraniolo,

en presencia de un medio de condensación alcalino con un



213418

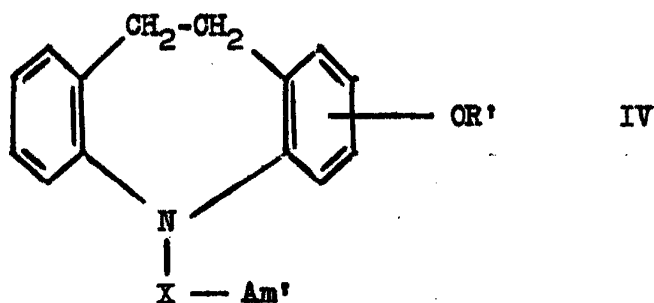
éster apto para reaccionar, de un alcohol de fórmula general



en la que Am' significa un radical correspondiente a la definición para Am, con excepción de un grupo monoalkilamino, o un grupo N-arilmetil-alkilamino, o grupos N-acil-alkilamino inferiores, y

X tiene la significación antes indicada.

En caso de necesidad seguidamente se transforma el producto de condensación de fórmula general IV que ya comprende una parte de los compuestos de fórmula general I



según la significación de R' y Am' mediante hidrólisis, preferentemente ácida, o por reacetilización, o bien por hidrogenólisis, en un compuesto de la fórmula general I, antes definida, en la que R está materializada por hidrógeno y/o Am por un grupo alkilamino inferior.

Como medios de condensación alcalinos para la transposición de compuestos de fórmula general II con ésteres aptos para reaccionar de alcoholes básicos de fórmula general III son apropiadas particularmente amida sódica, amida de litio, amida potásica, sodio, potasio, litio butílico, litio fenílico, hidruro sódico o hidruro de litio. La transposición



258418

puede llevarse a cabo en presencia o en ausencia de un disolvente orgánico inerte, de los cuales se citan a título de ejemplo benceno, tolueno, y xilenos.

5 La hidrogenólisis a llevar a cabo en caso deseado, es decir la sustitución de un radical aralkilo R' por hidrógeno puede tener lugar, por ejemplo en una solución orgánica, o preferiblemente ácida, acuoso-orgánica, por ejemplo en ácido clorhídrico metanólico en presencia de un catalizador de níquel o de metal noble. Así, por ejemplo es llevada a cabo la hidrogenólisis en presencia de carbón de paladio a temperatura ambiente y presión normal hasta la absorción de aproximadamente la cantidad molar de hidrógeno. Para la disociación simultánea de un radical aralkilo que se encuentra en el grupo Am' se necesita las más de las veces condiciones reaccionales algo más enérgicas, por ejemplo la hidrogenación en presencia de níquel de Raney a temperaturas de hasta unos 80° y presiones de hasta aproximadamente 50 atmósferas; la hidrogenación no es interrumpida en este caso, sino después de la absorción de aproximadamente la cantidad molar doble de hidrógeno.

10. En los compuestos de fórmula general I es materializada R por ejemplo por hidrógeno, el radical metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, bencilo, o benzhidrilo, X por ejemplo por el radical etileno, 1,2-propileno, 1,3-propileno, 2-metil-1,3-propileno, 2,3-butileno, 1,3-butileno, 1,4-butileno, 2,2-dimetil-1,3-propileno, 1,5-pentileno, o 1,6-hexileno, y Am por ejemplo por el radical metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino, n-butilamino, isobutilamino, dimetilamino, metiletilamino, dietilamino, di-n-propilamino, metilisopropilamino, di-n-butilamino, diisobutilamino, pirrolidilo-(1), piperidino, hexametileno, morfolino, 4-metilpiperazinilo-(1), 4-acetoxi-etil-

25.

30.

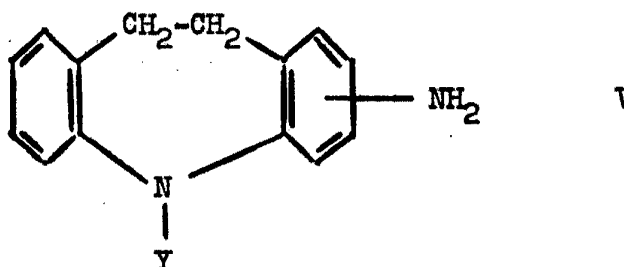


258418

-piperazinil-(1), o 4-hidroxi-etil-piperazinilo-(1), y X -
- Am juntas, además vg. por el radical 1-metil-piperidil-
-(3)-metilo, 1-metil-piperidil-(2)-etilo, o 1-metil-pirro-
lidil-(2)-etilo.

5. Las sustancias de partida de fórmula general II son preparadas, por ejemplo del modo siguiente:

Se transforma un aminocompuesto de fórmula general

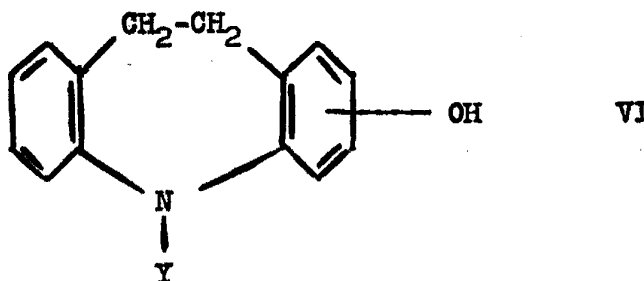


en la que significa

Y un radical acilo, fácilmente dissociable, particularmente el radical acetilo,

10.

en una sal de diazonio correspondiente de un oxácido no reductor, como por ejemplo ácido sulfúrico, y se descompone esta última por calentamiento con agua o ácido acuoso excesivo. El hidroxilcompuesto obtenido de fórmula general



15.

es transpuesto con un medio de alquilación de bajo peso molecular, con un halogenuro de aralkilo, o alfa-halógeno-dialkiléter, en presencia de un fijador de ácidos, o con



258418

dihidropirano, o un éter vinilalquílico y el producto reaccional es sometido a la hidrólisis, preferiblemente alcalina con la finalidad de disociar el radical Y. La disociación de este radical puede tener lugar eventualmente también antes

5.

de la eterificación, o acetalización, del grupo hidroxilo. Los compuestos de fórmula general V indicados en lo expuesto antes, a su vez pueden ser preparados, vg, por reacción Schmidt con compuestos correspondientes que llevan en vez del grupo amino un radical acetilo y a continuación por hidrólisis parcial de los acetaminocompuestos formados bajo conservación del radical 5-acilo Y, materializado de preferencia por el radical acetilo, por ejemplo mediante ebullición con ácido clorhídrico 2-n hasta la completa disolución del producto en el ácido.

10.

15.

El 2-hidroxi-iminodibencilo que pertenece a los productos de hidrólisis de compuestos de fórmula general VI, también puede ser obtenido a base de iminodibencilo (10,11-dihidro-5H-dibenzo[b,f]azepina) por oxidación mediante una solución de di-sulfonato potásico nitroso (sal de Fremy) en la 2-oxo-10,11-dihidro-2H-dibenzo[b,f]azepina y reducción de esta última por la vía catalítica o química.

20.

Por lo demás se obtiene el 4-hidroxi-5-benzoil-iminodibencilo y 4-hidroxi-5-acetil-iminodibencilo que recae bajo la fórmula general VI, con la cantidad equimolar de peróxido de benzoílo, o bien peróxido de acetilo, por ejemplo en solución de cloroformo en frío.

25.

La introducción del radical R' en los compuestos de fórmula general VI, o en sus productos de hidrólisis, obtenidos por ejemplo por ebullición con lejía potásica alcohólica, puede tener lugar por ejemplo mediante transposición con un éster apto para reaccionar de un alcohol de bajo peso molecu-

30.



258418

lar, como sulfato de dimetilo, sulfato de dietilo, yoduro de metilo, metiléster p-toluensulfónico, metiléster 2,4-dinitrobencensulfónico, bromuro de etilo, yoduro de etilo, bromuro de n-propilo, bromuro de n-butilo, o bromuro de isobutilo, en presencia de hidróxido potásico, o por ejemplo también mediante transposición con diazometano como medio de alquilación de bajo peso molecular. Los halogenuros alifáticos antes indicados pueden ser substituídos también por ejemplo por halogenuros de bencilo y halogenuros de bencilhidrido. Si la hidrólisis tiene lugar después de la esterificación, entonces la elaboración ulterior del éter eventualmente no sólo no es necesaria, sino incluso inconveniente debido a la hidrólisis parcial eventual, ya producida durante la esterificación. Si se prepara, en vez de éteres propiamente dichos, compuestos de carácter de acetal, por ejemplo mediante transposición de compuestos de fórmula general VI con dihidropirano o con éter clorodimetílico, entonces en la subsiguiente hidrólisis, como es natural es particularmente indicado el empleo de medios alcalinos, como de la lejía potásica alcohólica ya indicada.

Como ejemplos de sustancias de partida de fórmula general II se cita el 2-benciloxi-iminodibencilo (2-benciloxi-10,11-dihidro-5H-dibenzo[b,f]azepina), 2-benzohidri-
loxi-iminodibencilo, 2-metoxi-iminodibencilo, 2-ttetrahi-
dropiranyl-(2')-oxi)-iminodibencilo, 3-benciloxi-iminodi-
bencilo, 3-metoxi-iminodibencilo, 3-etoxi-iminodibencilo, 3-ttetrahidropiranyl-(2)-oxi)-iminodibencilo, 3-metoxime-
toxi-iminodibencilo, 3-(alfa-etoxi-etoxi)-, 4-metoxi- y
4-benciloxi-iminodibencilo.

Como ésteres aptos para reaccionar de alcoholes de



fórmula general III entran en consideración particularmente los halogenuros, citándose individualmente:

Cloruro de beta-dimetilamino-etilo, cloruro de beta-dietilamino-etilo, cloruro de beta-metil-etilamino-etilo, cloruro de beta-dimetilamino-propilo, cloruro de beta-dimetilamino-isopropilo, cloruro de gamma-dimetilamino-propilo, cloruro de gamma-dimetilamino-beta-metil-propilo, cloruro de delta-dimetilamino-butilo, cloruro de beta-(di-n-propilamino)-etilo, cloruro de beta-(N-metil-isopropilamino)-etilo, cloruro de beta-(di-n-butil-amino)-etilo, cloruro de beta-(di-isobutil-amino)-etilo, cloruro de beta-pirrolidil-(1)-etilo, cloruro de beta-piperidino-etilo, cloruro de gamma-pirrolidil-(1)-propilo, cloruro de gamma-piperidino-propilo, cloruro de gamma-hexametilenimino-propilo, cloruro de beta-morfolino-etilo, cloruro de beta-(4-metilpiperazinil-(1)-propilo, cloruro de beta-[4-acetoxietil-piperazinil-(1)]-etilo, cloruro de gamma-[4-acetoxietil-piperazinil-(1)]-propilo, cloruro de 1-metil-piperidil-(3)-metilo, cloruro de beta-[1-metil-piperidil-(2)]-etilo, cloruro de beta-[1-metil-pirrolidil-(2)]-etilo, cloruro de beta-(N-formil-etilamino)-etilo, cloruro de gamma-(N-carbetoxi-amino)-propilo, cloruro de gamma-(N-metansulfoniletilamino)-propilo y cloruro de gamma-(N-p-toluensulfonilamino)-propilo, así como los bromuros y yoduros correspondientes.

Los compuestos que pueden ser preparados con arreglo a la invención poseen particularmente eficacia antialérgica, sedante, serotoninantagónica, antipirética y timoléptica con efectos secundarios vegetativos solamente reducidos. Son apropiados por ejemplo para el tratamiento de ciertas formas de enfermedades mentales, particularmente depresiones



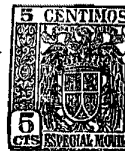
de ánimo, a cuyo efecto pueden ser aplicados por vía bucal, o en forma de soluciones acuosas de sales no tóxicas, también parenteralmente. En parte se prestan asimismo como productos intermedios para la preparación de sustancias ulteriores con propiedades similares.

Los compuestos que pueden ser preparados según la invención de fórmula general I forman sales que en parte son hidrosolubles con ácidos inorgánicos u orgánicos como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido metansulfónico, ácido etandisulfónico, ácido acético, ácido succínico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido málico, ácido tartárico, ácido cítrico, ácido benzoico y ácido ftálico.

Los ejemplos siguientes dilucidarán más detenidamente la preparación según el invento de compuestos de fórmula general I, si bien de ninguna manera representan las únicas posibilidades de realización de los mismos. En los ejemplos en tanto que no se observe otra cosa, las partes significan partes en peso; éstas se comportan con respecto a las partes en volumen como el gramo al centímetro cúbico. Las temperaturas están indicadas en grados Celsius.

EJEMPLO 1.

a) 3 partes de iminodibencilo son disueltas en 300 partes en volumen de acetona. A esta solución se añade en 10 porciones dentro de 15 minutos una solución de 9 partes de disulfonato potásico nitroso (sal de Fremy) y 75 partes en volumen de m/6 fosfato disódico en 525 partes de agua, a cuyo efecto el color de la solución vira de azul al pardo rojizo. Si ha quedado adicionada toda la solución salina, el conjunto es filtrado a través de una capa de Hyflo y se elimina del filtrado la acetona por evaporación al vacío. De la solución



27-118

acuosa remanente cristaliza la 2-oxo-10,11-dihidro-2H-dibenzo[b,f]azepina. Para su purificación es cromatografiada en una columna de gel de sílice, a cuyo efecto es eluida la substancia pura mediante mezclado de 90% de benceno y 10% de éter. Después de cristalización de éter de petróleo funde a 105 - 106°.

5.

b) 18,6 partes de 2-oxo-10,11-dihidro-2H-dibenzo[b,f]azepina son disueltas en 450 partes en volumen de metanol y sacudidas en presencia de 2 partes de catalizador de Lindlar a temperatura ambiente en atmósfera de hidrógeno, hasta que haya quedado absorbida la cantidad calculada de hidrógeno (1790 partes en volumen). Se separa por filtración del catalizador y se concentra el metanol bajo nitrógeno al vacío. El residuo sólido es recristalizado de cloroformo, a cuyo efecto es obtenido 2-hidroxi-iminodibencilo (2-hidroxi-10,11-dihidro-5H-dibenzo[b,f]azepina del punto de fusión 168 - 169°.

10.

15.

c) La 2-oxo-10,11-dihidro-2H-dibenzo[b,f]azepina obtenida según a) también puede ser reducida por la vía química. Por ejemplo es disuelta 1,0 parte de esta substancias en 40 partes en volumen de metanol y la solución de un rojo subido es mezclada con una solución de 1,6 partes de hidrosulfito sódico en 10 partes de agua, a cuyo efecto se produce decoloración. La solución es vertida en mucha agua y extraída con éter. La solución etérea es lavada con agua, secada y evaporada. El residuo es recristalizado de poco cloroformo, a cuyo efecto se obtiene el 2-hidroxi-iminodibencilo.

20.

25.

d) 18,6 partes de 2-hidroxi-iminodibencilo son disueltas en una solución de 6 partes de hidróxido potásico en 180 partes en volumen de alcohol absoluto, mezcladas con 11,5

30.



253418

partes de cloruro de bencilo y hervidas durante 18 horas bajo reflujo. Seguidamente se separa el alcohol mediante destilación y se recoge el residuo en éter. La solución etérea es lavada con lejía de sosa diluida y a continuación con agua, siendo secada y evaporada. El residuo es 5. recristalizado de éter-pentano. El 2-benciloxi-iminodibencilo así obtenido, funde a 92 - 94°.

10. e) La base liberada de 9 partes de clorhidrato de cloruro de gamma-dimetilaminopropilo y 14,3 partes de 2-benciloxi-iminodibencilo son disueltas en 200 partes en volumen de benceno y mezcladas a 50° con una suspensión de 2,5 partes de amida sódica en tolueno. A continuación se hierve la mezcla reaccional durante 18 horas bajo reflujo. Seguidamente es 15. enfriada y disociada con agua. La fase bencénica es sacudida cuatro veces con cada vez 2,5 partes en volumen de ácido clorhídrico 1-n y los extractos ácidos son alcalinizados con lejía de sosa concentrada. La base segregada es recogida en éter, la solución etérea es lavada a fondo con agua, secada y evaporada. El residuo es destilado al 20. alto vacío, el 2-benciloxi-5-(gamma-dimetilamino-propil)-iminodibencilo se pasa bajo 0,002 mm de presión a 212 - 215°.

25. De manera análoga es obtenido con empleo de la base, liberada de 11 partes de clorhidrato de cloruro de beta-dietilamino-propilo el 2-benciloxi-5-(beta-dietilamino-propil)-iminodibencilo.

30. f) 1,23 partes del destilado anterior son disueltas en 30 partes en volumen de metanol y 5 partes en volumen de ácido clorhídrico 1-n, y sacudidas en presencia de 0,36 partes de paladio sobre carbón a temperatura ambiente hasta la absorción de la cantidad de hidrógeno teórica. Seguidamente se separa por aspiración del catalizador y se con-



252418

centra el filtrado al vacío. El residuo remanente es alcalinizado con amoníaco concentrado, a cuyo efecto precipita cristalino el 2-hidroxi-5-(gamma-dimetilamino-propil)-iminodibencilo. Puede ser recristalizado de acetona-éter.

5. Punto de fusión 132 - 133°.

EJEMPLO 2.

10. a) 25,2 partes de 3-amino-5-acetil-iminodibencilo son disueltas en 150 partes en volumen de agua y 30 partes en volumen de ácido sulfúrico concentrado y diazotadas a 0° con 7 partes de nitrito sódico en 20 partes en volumen de agua. Después de dejar en reposo durante 1/4 de hora la solución es calentada a 80°. Una vez terminada la generación de nitrógeno, la solución es enfriada y el producto reaccional resinoso es segregado. Es disuelto en éter caliente, la solución etérea es filtrada para la eliminación de producto secundario rojizo insoluble, y el filtrado es evaporado a sequedad. El residuo pasa pasajeramente en disolución al ser mezclado con poco benceno y cristaliza inmediatamente. Recristalizado de benceno es obtenido un producto que contiene benceno de cristalización (aproximadamente 2/3 moles de benceno) que funde definitivamente a 104 - 104,5°. Mediante breve calentamiento más allá del punto de fusión es obtenido en 3-hidroxi-5-acetil-iminodibencilo exento de benceno que funde a 78 - 82°.
25. b) 25,3 partes de 3-hidroxi-5-acetil-iminodibencilo son disueltas en éter y a esta solución son agregadas 5 partes de diazometano en éter, siendo generado nitrógeno inmediatamente. Después de un reposo prolongado a temperatura ambiente es destruido diazometano excesivo por adición de unas
30. cuantas gotas de ácido acético. 3-hidroxi-5-acetil-iminodi-

258418



5.
10.
bencilo no transpuesto es eliminado de la solución etérea mediante sacudidas con lejía de sosa diluída. Después de lavado con agua y secado de la solución etérea ésta es evaporada a sequedad. El oleaginoso residuo verdoso es calentado en 250 partes en volumen de alcohol que contiene 10 partes de hidróxido potásico, durante 4 horas a ebullición. Al enfriar cristaliza el producto reaccional. Después de diluir con agua los cristales son filtrados por aspiración, lavados a fondo con agua y secados. Por recristalización de hexano se obtiene el 3-metoxi-iminodibencilo en forma de cristales amarillentos que funden a 94°.

15.
20.
25.
c) 22,5 partes de 3-metoxi-iminodibencilo son disueltas en 250 partes en volumen de xileno absoluto y calentadas a 90 - 100° con 4,3 partes de amida sódica pulverizada en tolueno durante tres horas bajo agitación. Seguidamente es adicionado cloruro de gamma-dimetilamino-propilo (liberado de 16 partes del clorhidrato y recogido en xileno) y calentado durante 20 horas bajo reflujo. La base es extraída de la mezcla reaccional con ácido clorhídrico 2-n y seguidamente liberada con lejía de sosa 5-n. La base libre es recogida en éter. Después del secado con sulfato sódico y eliminación por evaporación del éter queda remanente un aceite que destila al alto vacío a 140 - 142°/0,001 mm. Si la base purificada es introducida en ácido clorhídrico 2-n, entonces cristaliza al cabo de un reposo de varias horas el clorhidrato del 3-metoxi-5-(gamma-dimetilamino-propil)-iminodibencilo del punto de fusión 177°.

30.
De modo análogo se obtiene bajo empleo de la base liberada de 20 partes de clorhidrato de cloruro de beta [1-metil-piperidil-(2)]-etilo el 3-metoxi-5-[beta-(1'-metil-pipe-



258418

ridil-(2')-etil-7-iminodibencilo.

EJEMPLO 3.

5. a) 25,3 partes de 3-hidroxi-5-acetil-iminodibencilo son disueltas en una solución de alcoholato sódico, preparada a base de 2,3 partes de sodio y 200 partes en volumen de alcohol absoluto. A la solución roja son adicionadas 12,7 partes de cloruro de bencilo, después de lo cual comienza a segregarse inmediatamente cloruro sódico. Después de una ebullición de 15 horas bajo reflujo el cloruro sódico es separado por filtración y la solución es concentrada al vacío. El residuo es recogido en éter y hidroxicompuesto eventual no transpuesto es eliminado por sacudida con lejía de sosa 2-n. La solución etérea seguidamente es lavada con agua, secada con sulfato sódico y evaporada a sequedad. El 10. 3-benciloxi-5-acetil-iminodibencilo cristalino remanente puede ser recristalizado de poco alcohol y funde a 91°.

15. b) 34,3 partes de 3-benciloxi-5-acetil-iminodibencilo son hidrolizadas por ebullición durante 10 horas con lejía potásica alcohólica (12 partes de KOH en 250 partes en volumen de alcohol). Seguidamente la solución es concentrada al vacío. El residuo oleaginoso es mezclado con agua y el 20. 3-benciloxi-imino-dibencilo es extraído con éter. La solución etérea secada es evaporada a sequedad. El aceite obtenido cristaliza después de haber estado en reposo durante 25. unas 24 horas. Después de recristalización de benceno-éter de petróleo funde el 3-benciloxi-iminodibencilo a 111°.

30. c) 4,3 partes de 3-benciloxi-iminodibencilo bruto son disueltas en 60 partes en volumen de tolueno absoluto y la solución hirviendo bajo reflujo es mezclada a gotas con 1,6 partes de una suspensión al 33% de amida sódica en to-



253418

luego absoluto. Al cabo de 2 horas es añadida una solución recién preparada mediante liberación de la base del clorhidrato, de 2 partes de cloruro de beta-piperidino-etilo en 40 partes en volumen de tolueno absoluto y seguidamente aun 0,8 partes en volumen de la suspensión de amida sódica. Al cabo de una ebullición durante 14 horas bajo reflujo es enfriada la mezcla reaccional; mezclada con agua y se separa las fases. La capa orgánica es extraída tres veces con ácido clorhídrico 2-n, los extractos clorhídricos reunidos son puestos básicos con solución de amoníaco concentrada y la suspensión obtenida es extraída con éter. El extracto etéreo es secado sobre sulfato sódico y evaporado, a cuyo efecto queda remanente el 3-benciloxi-5-(beta-piperidino-etil)-iminodibencilo bruto. Este es transformado mediante solución de ácido clorhídrico etanólico en el clorhidrato y este último es recristalizado de metanol/acetona. Punto de fusión 208 - 209°, después de transformación en agujas finas, encima de 185°.

De modo análogo se obtiene el 3-benciloxi-5-(gamma-dimetilamino-propil)-iminodibencilo del punto de ebullición $0,025^{202^{\circ}}$, partiendo de 3-benciloxi-iminodibencilo y cloruro de gamma-dimetilamino-propilo; y el 3-benciloxi-5-[gamma-(4'-metil-piperazinil-1')-beta-metil-propil]-iminodibencilo del punto de ebullición $0,008^{260^{\circ}}$ con empleo de 3-benciloxi-iminodibencilo y de cloruro de gamma-(4-metil-piperazinil-1)-beta-metil-propilo.

d) Mediante hidrogenólisis de modo análogo al ejemplo 1 f) se obtiene a base de los 3-benciloxi-iminodibencilos 5-substituidos anteriores los correspondientes 3-hidroxi-iminodibencilos 5-substituidos, es decir 3-hidroxi-5-(beta-piperidino-etil)-iminodibencilo, 3-hidroxi-5-(gamma-dime-



25-418

tilamino-propil)-iminodibencilo, y 3-hidroxi-5-(γ -(4'-
-metil-piperazinil-1')-beta-metil-propil)-iminodibencilo.

5. e) De modo análogo a los párrafos anteriores a) y b) se
obtiene, partiendo del 4-hidroxi-5-benzoil-iminodibencilo
(obtenido por oxidación de iminodibencilo con peróxido de
benzofeilo en solución clorofórmica a 10°, punto de fusión
171°) el 4-benciloxi-iminodibencilo y a base de éste, de mo-
do análogo a c), o bien al ejemplo 1 f), el 4-benciloxi-5-
-5-(γ -dimetilamino-propil)-iminodibencilo y el 4-hidroxi-
10. -5-(γ -dimetilamino-propil)-iminodibencilo.

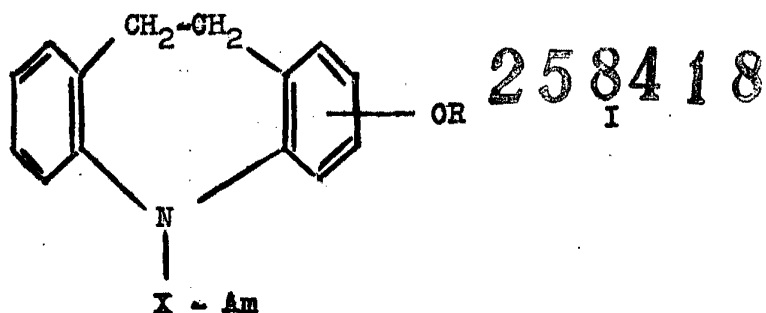
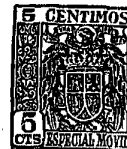
15. La invención, dentro de su esencialidad, puede ser
desarrollada en otras formas de realización que difieran en
detalle de la indicada a título de ejemplo, a las cuales al-
canzará igualmente la protección que se recaba. Podrá, pues,
realizarse con los medios y aparatos más adecuados, por que-
dar todo ello comprendido dentro del espíritu de las rei-
vindicações.

= . =

N O T A

20. Descrito el invento, se declaran nuevas y de propia
invención las siguientes reivindicaciones, con prioridades
de las patentes suizas Nº 73.683 de 28 de Mayo de 1.959,
979/60 del 29 de enero de 1.960 y 981/60 del 29 de enero de
1.960.

25. 1. Procedimiento para la preparación de nuevos de-
rivados del iminodibencilo, caracterizado porque se preparan
compuestos de fórmula general

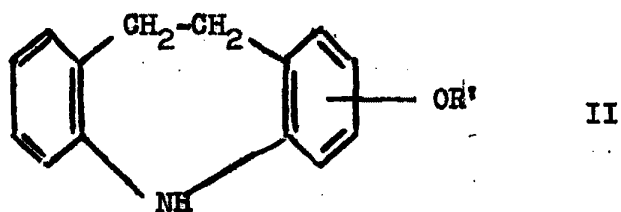


en la que significan

R hidrógeno, un radical alquilo inferior, o un radical aralkilo,

X un radical alquileo de cadena recta, o ramificado, con 2 a 6 átomos de carbono, y

Am un grupo alquilamino o dialkilamino inferiores, a cuyo efecto uno de ambos radicales alquilo de un grupo dialkilamino Am puede estar enlazado directamente con el radical alquileo X, o ambos radicales alquilo entre sí directamente, o por un átomo de oxígeno, un grupo alquilimino, hidroxialkilimino o alcanciloxialkilimino inferiores, transponiendo un compuesto de fórmula general



en la que significan

R' un radical alquilo inferior, un radical aralkilo, un radical alfa-alcóxi alquilo o el radical tetrahidropirranilo,

en presencia de un medio de condensación alcalino, con un éster apto para reaccionar de un alcohol de fórmula general



HO - X - Am'

III

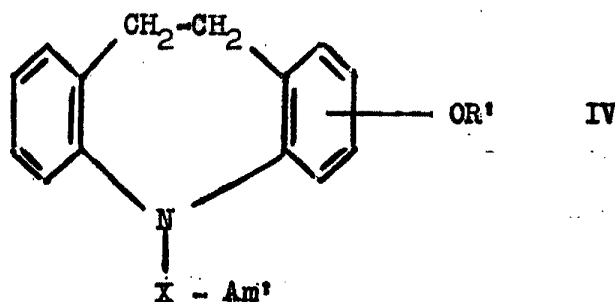
258418

en la que significa

Am' un radical correspondiente a la definición para Am, con excepción de un grupo monoalkilamino, o un grupo N-arilmetil-alkilamino, o un grupo N-acil-alkilamino inferiores,

5.

y porque se transforma en caso de necesidad el producto de condensación de fórmula general IV que ya comprende juntamente una parte de los compuestos de fórmula general I



según el significado de R' y Am' por hidrólisis, preferiblemente ácida, o mediante reacetilización, o bien por hidrogenólisis, en un compuesto de fórmula general I, en la que R está materializada por hidrógeno y/o Am por un grupo alkilamino inferior.

10.

2. Procedimiento para la preparación de nuevos derivados del iminodibencilo.

15.

Según se describe y reivindica en la presente memoria que consta de dieciocho páginas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 27 de Mayo de 1.960.

20.

J.R. GEIGY A.G.
p. a.

JAIME ISERN

R/pp.