

260975

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

POUR «PROCÉDÉMENT POUR PRÉPARER NOUVEAUX COMPOSÉS H-HÉTÉROCYCLISÉS», A FAVOR DE LA FIRMES SUISSE J. R. GIROY S. A. S., SÉJOURNÉE EN BASILE (SUISSE).

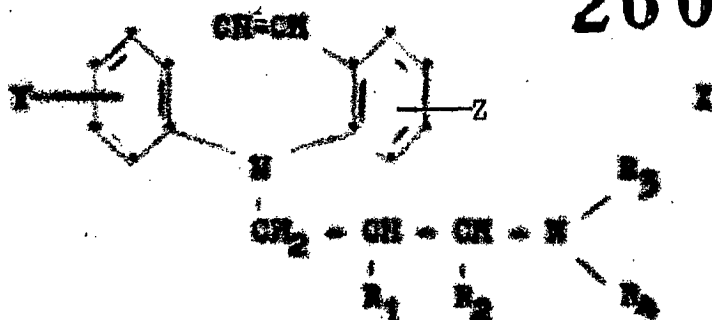
• • •

MEMOIRE DESCRIPTIVE

Cette invention se rapporte à nouveaux composés H-hétérocycliques dotés de valieuses propriétés pharmacologiques, ainsi qu'à un procédé pour les préparer.

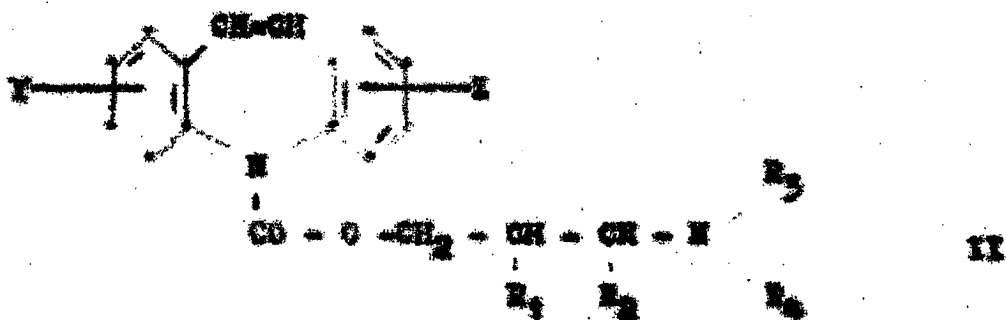
5. Elle a été découverte que les hétérocycliques substitués principalement (H-hétérocycliques) de la formule générale

260975



en la que Y representa hidrógeno o un átomo de halógeno,
 Z representa hidrógeno o un átomo de halógeno,
 uno de los símbolos R_1 y R_2 representa el grupo metilo,
 mientras el otro símbolo representa hidrógeno, y
 R_3 y R_4 representan radicales inferiores de alquilo o
 radicales inferiores de alquilo, que pueden estar
 unidos entre sí directamente o por medio de un átomo
 de oxígeno o un grupo inferior alquilino, di-
 caniloxialquilino o hidroxialquilino,
 poseen valiosas propiedades farmacológicas, y en particular
 actividad espasmolítica, antialérgica, sedante, anticonvulsi-
 va y antiepileptica.

Los compuestos de la fórmula general I anteriormente
 definida pueden prepararse calentando, hasta desdoblamiento
 de un mol de anhídrido carbónico, un compuesto de la fórmula
 general



en la que Y, Z, R_1 , R_2 , R_3 y R_4 tienen el significado indi-

Celsius.

260975

EJEMPLO.

5. Se mantiene en reflujo, durante 17 horas, 12,9 partes de cloruro del ácido iminoestilben-5-carboxílico, disueltas en 100 volúmenes de tolueno absoluto, con 17,2 partes de gamma-dimetilamino-beta-metil-propenal. A continuación se separan las porciones básicas agitando por tres veces con ácido clorhídrico diluido. Los extractos reunidos se alcalinizan y agotan con éter, se secan sobre carbonato potásico la solución etérea y se concentra, con lo que se obtiene éter gamma-dimetilamino-beta-metil-propílico del ácido iminoestilben-5-carboxílico. Por calentamiento a 185-250° durante una hora se obtiene, por desdoblamiento de CO₂, el N-(gamma-dimetilamino-beta-metil-propil)-iminoestilbeno, de punto de ebullición 0,025 158-161° y punto de fusión 77-78° (en acetona). El clorhidrato preparado con ácido clorhídrico estabílice funde a 202-205° (en acetona).
- 10.
- 15.

20. 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 alcanzará igualmente la protección que se solicita. Podrá, pues, realizarse con los medios y aparatos más adecuados, por quedar todo ello comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.

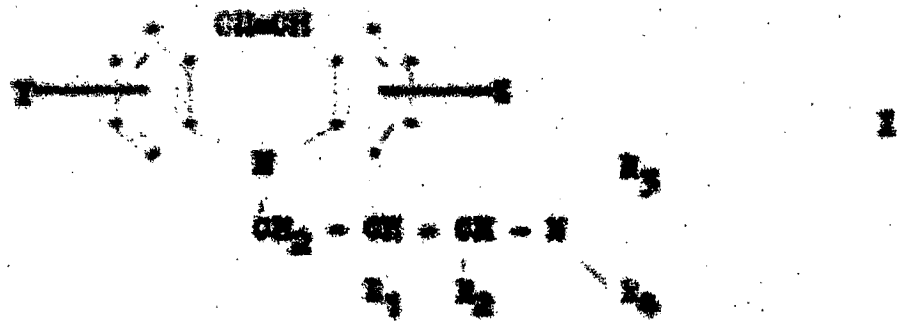
260975

NOVA

Descrito el objeto de la invención, lo que se declara
nueva y de propia invención, comprende las siguientes reivin-
dicaciones, con prioridades sucesivas, núm. 77 491, del 28.8.59;
299/60, del 13.7.60; 2102/60, del 25.2.60, y del 11.2.60,
existentes en todas ellas unidas de invención:

5.

1. Procedimiento para preparar nuevos compuestos
N-heterocíclicos de la fórmula general



en la que Y representa hidrógeno o un átomo de halógeno,
E representa hidrógeno o un átomo de halógeno,

10.

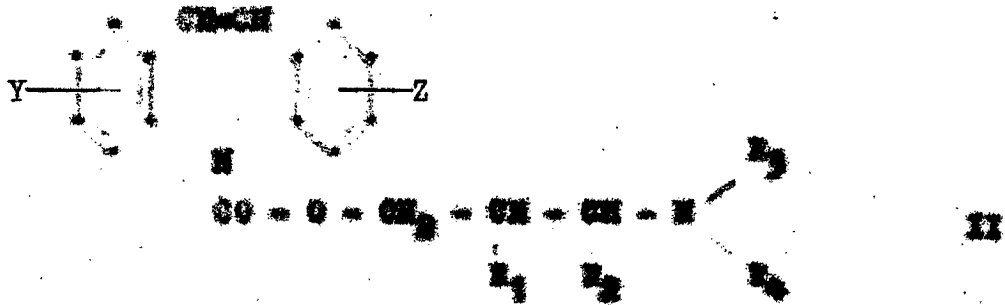
uno de los símbolos R1 y R2 representa el grupo metilo,
mientras el otro representa hidrógeno, y

R3 y R4 representan radicales inferiores de alquilo,
o radicales inferiores de alilo, que pueden
estar unidos entre sí directamente o por medio
de un átomo de oxígeno o un grupo inferior al-
kilino, alcoxilalquilino o hidroalquil-
ino,

15.

260975

procedimiento caracterizado por el hecho de que se calienta un compuesto de la fórmula general



en la que Y, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ tiene el significado indicado antes, hasta la desproporción de un mol de hidrógeno carbónico.

3.

2. Procedimiento para preparar nuevos compuestos N-heterocíclicos.

Según se describe y reivindica en la presente memoria, la cual consta de seis hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

10.

Madrid, a 27 de Agosto de 1.955.

J.F. CEJOT A.G.

De fe.

JANE SERA MIRALLES
P. C.