

25 FEB.



310184

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

a favor de LABORATORIOS MIQUEL, S. A., entidad española, domiciliada en Barcelona, Calle Viladomat, 71, por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE UN NUEVO DERIVADO DE PIRAZOLIDINA-HEXAMETILENIMINA CON PROPIEDADES TERAPÉUTICAS".

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de pirazolidina-hexametilenimina con propiedades terapéuticas.

5. Es conocido el elevado poder analgésico de 1-metil-4-carbetoxy-4-fenil hexametilenimina y su satisfactoria inocuidad cuando se usa en el tratamiento de procesos que transcurren con una componente álgica. De otro aspecto, 1,2-Difenil-4-butil-3,5-Dioxopirazolidina presenta también pronunciadas propiedades anal-
- 10.

310184

25 FEB



gésicas y antipiréticas asociadas en este caso a un poder antiinflamatorio realmente manifiesto,

5. El objeto de la presente invención, es la descripción de un procedimiento para la preparación de una nueva especie química que, como destacable propiedad terapéutica presenta su elevado poder antiinflamatorio complementado sinérgicamente por una destacada componente analgésica cuando se aplica en dosis adecuadas.

10. Para ello, la nueva especie química resulta de la condensación de los productos citados aprovechando el carácter ácido del segundo y el claramente básico del primero para formar una sal cuyo catión esté formado por 1-metil-4-carbetoxi-4-fenil-hexametilenimina, y el anión por 1,2-difenil-4-butil-3,5-dioxipirazolidina.

15. Se ha comprobado que poniendo en contacto en condiciones adecuadas y en proporciones equimoleculares los compuestos citados, obtenemos un compuesto que por sus propiedades químicas y físicas, responde a la nueva especie química formada por la sal de 1,2-difenil-4-butil-3,5-Dioxipirazolidin-1-metil-4-carbetoxi-4-hexametilenimonio.

20. La recuperación del producto puede realizarse previo enfriamiento de la masa reaccionante y cristalización del mismo con disolventes polares.

25. Para una mejor comprensión de cuanto se ha descrito, se acompañan unos ejemplos en los que, tan sólo a título ilustrativo y no limitativo del alcance de la presente invención, se dan dos casos prácticos de pre-

310184

25 FEB. 1967



paración del citado compuesto.

EJEMPLO 1.

5. Veinte gramos de 1,2-Difenil-4-butil-3,5-dioxo-  
pirazolidina se mezclan concienzudamente con 16'99 g. de  
1-metil-4-carbetoxi-4-fenil-hexametilenimina y se agita  
cuidadosamente hasta conseguir una mezcla homogénea, se  
abandona durante una noche, y el residuo vítreo se re-  
cristaliza en alcohol etílico del 80%. Es un producto  
blanco de punto de fusión 118-120<sup>o</sup> C.

10. EJEMPLO 2.

Se colocan en un recipiente 68 gramos de 1,2-  
Difenil-4-butil-3,5-dioxopirazolidina y se calienta el  
producto a 100-110<sup>o</sup> C, adicionando con agitación, gota a  
gota, 52 gramos de 1-metil-4-carbetoxi-4-fenil-hexame-  
15. tilenimina. Al final de la adición queda un líquido  
espeso que se mantiene a la temperatura indicada duran-  
te 20 minutos que se deja enfriar dando un sólido vítreo  
que recristalizado de alcohol-agua funda a 118-120<sup>o</sup> C.

20. Por lo demás, serán independientes del alcance  
de la presente invención los detalles y características  
accesorios empleados en su puesta en práctica, así como  
los medios y aparatos empleados por quedar todo ello  
comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.

25. - . -

310184

25 FEB



N O T A

Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

5. 1. Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de pirazolidina-hexametilenimina con propiedades terapéuticas, caracterizado esencialmente por el hecho de poner en contacto a temperatura ordinaria el ácido 1,2-difenil-4-butil-3,5-dioxipirazolidina y la base 1-metil-4-carbetoxi-4-fenil-hexametilenimina.
10. 2. Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de pirazolidina-hexametilenimina con propiedades terapéuticas, según la reivindicación 1, caracterizado esencialmente por el hecho de poner en contacto dichos cuerpos a temperatura de 100°C.
15. 3. Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de pirazolidina-hexametilenimina con propiedades terapéuticas.

La presente memoria consta de cuatro hojas foliadas escritas a máquina por una sola cara.

Barcelona, 25 de febrero de 1.965

LABORATORIOS MIQUEL, S.A.

p.a.