



327433

3 2 7 4 3 3

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

a favor de:

FARBWERKE HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, vormalis Meister Lucius & Brüning, de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (E) - Hoechst (República Federal Alemana), por:

"PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE 2-ETIL-AMINO-4-FENIL-6-CLORO-4H-3,1-BENZOTIAZINA".

Memoria descriptiva

El objeto del invento lo constituye un procedimiento para la preparación de 2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzotiazina, que se caracteriza porque se hace reaccionar 5-cloro-2-amino-benzohidrol con isotiociana to de etilo y porque se trata con ácidos la N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxi-bencil)]-fenil-tiourea obtenida.

El producto del procedimiento posee, junto con escasa toxicidad, valiosas propiedades farmacológicas, en especial una acción sicotrópica. Sirve para el tratamiento de enfermedades síquicas, por ejemplo, depresiones, siconeurosis, disgustos y estados de angustia de génesis neurótica y sicótica.

327433



Ejemplo

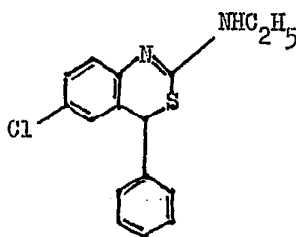
2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzotiazina

- 15 a) 35 g de 5-cloro-2-aminobenzohidrol se calientan junto con 26 g de isotiocianato de etilo durante 5 minutos sobre el baño de vapor y, a continuación, se dejan en reposo durante la noche a la temperatura ambiente. La papilla cristalina obtenida se hierve con 75 ml de benceno para eliminar el isotiocianato en exceso. Se obtienen de este modo 43 g (89% de la teoría) de N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxibencil)]-feniltiourea en forma de cristales incoloros de p. de f. 147-148°C. que, incluso después de re-
- 20 cristalización desde éster acético/éter de petróleo, permanece constante.
- b) 32 g de la tiourea obtenida según a) se hierven en 100 ml de ácido bromhídrico del 48% durante 1 hora con agitación a reflujo. La mezcla de reacción enfriada se alcaliniza con lejía de sosa cáustica diluida y se extrae varias veces con éster acético. Después de evaporar el disolvente
- 25 en el vacío queda un aceite amarillento que solidifica en forma cristalizada al cabo de algún tiempo. Por recristalización desde benceno/éter de petróleo se obtienen 25,6 g (85% de la teoría) de 2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzotiazina de p. de f. 118-120°C.

30 Esta solicitud corresponde a la presentada en Alemania el 3 de Junio de 1.965 bajo el número F 46 229 IVd/12p, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto de la Propiedad Industrial y del artículo 4º del Convenio de la Unión.

REIVINDICACIONES

- 35 1). Procedimiento para la preparación de 2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzotiazina de la fórmula



40

327433



caracterizado porque se hace reaccionar 5-cloro-2-aminobenzohidrol con isotiocianato de etilo y la N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxibencil)]-fenil-tiourea obtenida se trata con ácidos.

2). "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE 2-ETIL-AMINO-4-FENIL-6-CORO-4H-3,1-BENZOTIAZINA".

45

Esta Memoria consta de tres hojas foliadas y mecanografiadas por un sólo lado de sus caras.

Madrid, 1 de Junio de 1.966