

329569

9 JUL



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 OBTENCIÓN DE SALES 2-DIMETILAMINOETANOL-HEMISUCCÍNICAS DE 2,6-DIOXOPURINAS METILADAS".

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas,

5. El 2-dimetilaminoetanol tiene un parentesco químico muy pronunciado con la colina, de la cual difiere sólo por un grupo metilo.

Sus propiedades fisiológicas se manifiestan de una manera definida sobre todo mejorando la fatiga crónica, depresiones neuróticas y como estimulante suave del sistema nervioso central.

10.



Las propiedades psico-estimulantes, cardiacas y respiratorias de que goza la 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina están sobradamente comprobadas así como su inmediata y pronta manifestación.

5. El objeto de este invento es conseguir una unidad molecular en la que concurren, por una parte la componente estimulante suave y de efectos diferidos propia del dimetilaminoetanol, y por otra la potente y clara componente estimulante del derivado purínico sobre los sistemas nerviosos y cardio-circulatorios.

10. Se ha conseguido unir químicamente dimetilaminoetanol y las purinas citadas, a través del ácido succínico, en forma de un hemiéster con el primero y de una combinación molecular con las segundas.

15. Se ha comprobado que, poniendo en contacto una solución de dimetilaminoetanol con anhídrido succínico en un único disolvente orgánico, concentrando y enfriando, se obtiene un producto sólido cuyas características químicas responden al hemiéster succínico de dimetilaminoetanol.

20. Se ha comprobado asimismo que, poniendo en contacto el hemiester citado, disuelto en un disolvente orgánico, con 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina y concentrando el producto reaccionado, se obtiene la sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina.

25. Las pruebas farmacológicas realizadas, mediante registro actográfico, con el 2-dimetilaminoetanol-hemisucci-



nato de 1,3,7-trimetil-2,6,dioxopurina, muestran un evidente aumento de la motilidad espontánea, por lo que se puede clasificar como estimulante psicomotor.

5. La presencia en la misma molécula de los dos estimulantes centrales citados, permite disminuir, la dosis de cada uno de ellos por la sumación y potenciación de sus efectos.

10. Por otra parte, si la solución antes citada de hemisuccinato de dimetilaminoetanol es puesta, en presencia de un disolvente, frente a 3,7-dimetil-2,6-dioxopurina, se obtiene la sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 3,7,-dimetil-2,6-dioxopurina.

15. Finalmente si se pone en contacto una solución de hemisuccinato de dimetilaminoetanol, en un disolvente, orgánico, con 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina, se obtiene la sal 2-dimetilaminoetanol hemisuccínica de 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina.

20. Los ejemplos siguientes ilustran ulteriormente la invención sin limitarla a sus formas de realización específicas.

E J E M P L O I

Hemisuccinato de 2-Dimetilaminoetanol.

25. Se refluyen durante tres horas 60 g. de anhídrido succínico, 60 g. de 2-dimetilaminoetanol y 600 cc de acetona.

Se filtra el residuo que precipita y se concentra el líquido filtrado a una cuarta parte de su volumen, dejándolo precipitar en la nevera.



Se filtra el precipitado obteniéndose 110 g. de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol. Punto de fusión: 70-72°C.

EJEMPLO 2

5. Sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina.

110 g. de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol se disuelven en 1500 cc. de acetona junto con 55 g. de 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina y se refluyen durante una a dos horas.

Una vez refluído se concentra a sequedad y se seca a 30-35°C.

Rendimiento 160 g.

teórico 14,6 %

15.

% de N ...

obtenido 14,3 %

Agua : 12 cc a 20°C.

Alcohol: 20 cc a 55°C.

solubilidad del producto:
1 g. disuelve en

20.

Acetona: 20 cc a 50°C.

Benceno: 20 cc a 75°C.

EJEMPLO 3

Sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 3,7-dimetil-2,6-dioxopurina.

25.

19 g. de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol se disuelven en 300 cc. de acetona junto con 19 g. de 3,7-dimetil-2,6-dioxopurina y se refluje el conjunto durante dos horas.



Se concentra a sequedad y se seca a 30-35° C.

Rendimiento: 35 g.

E J E M P L O 4

Sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina.

5.

25. g. de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol se disuelven en 350 cc. de acetona junto con 25 g. de 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina y se refluje el conjunto durante dos horas.

10.

Se concentra a sequedad y se seca con precaución.

Rendimiento: 42 g.

Serán independientes del alcance de la invención los detalles accesorios y demás características que no alteren su esencialidad, tales como los medios y aparatos utilizados en la puesta en práctica de la misma, por quedar todo ello comprendido en el espíritu de las siguientes reivindicaciones.

15.

- . -

N O T A

Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

20.

1. Procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas, caracterizado esencialmente por el hecho de hacer reaccionar, en presencia de un disolvente orgánico, cantidades equimoleculares de hemisuccinato de 2-dimetilaminoe-



tanol y 2,6-dioxopurinas.

5. 2. Procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar una solución de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol en un disolvente orgánico, con una solución de 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina en el mismo disolvente, para obtener la sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 1,3,7-trimetil-2,6-dioxopurina.
10. 3. Procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar una solución de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol en un disolvente orgánico, con una solución de 3,7-dimetil-2,6-dioxopurina en el mismo disolvente, para obtener la sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 3,7-dimetil-2,6-dioxopurina.
15. 4. Procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar una solución de hemisuccinato de 2-dimetilaminoetanol en un disolvente orgánico, con una solución de 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina en el mismo disolvente, para obtener la sal 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínica de 1,3-dimetil-2,6-dioxopurina.
20. 5. Procedimiento para la obtención de sales 2-dimetilaminoetanol-hemisuccínicas de 2,6-dioxopurinas metiladas.
- 25.



La presente memoria consta de siete hojas folia-
das escritas a máquina por una sola cara.

Barcelona, 9 de julio de 1966.

LABORATORIOS MIQUEL, S.A.

p.a. **L. PONTI**
R.P.