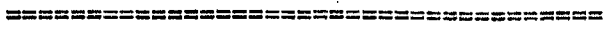




330103

MEMORIA DESCRIPTIVA



Correspondiente al registro de Patente de Invención que, por veinte años, se solicita para España y sus Colonias, a favor de la firma "SOCIEDAD ESPAÑOLA DE ESPECIALIDADES FARMACO-TERAPEUTICAS, S.A.", residente en Barcelona, Avda. San Antonio María Claret, nº 173 e - - - - -

5.

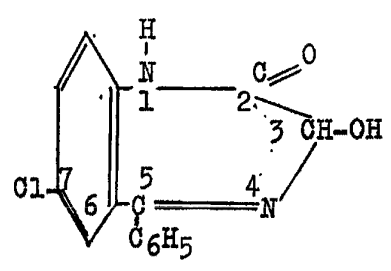
p o r

"UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACIÓN DE UN PRODUCTO BENZODIAZEPÍNICO"



10.

La presente Patente de Invención se refiere a un procedimiento para la preparación de un compuesto benzodiazepínico de la siguiente fórmula:

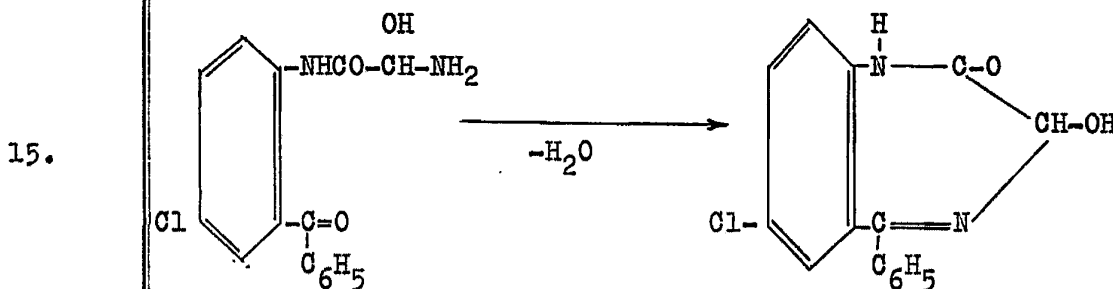




o sea el 7-cloro-5-fenil-3-hidroxi-1,3-dihidro-2H-1,4 benzodiazepin-2-ona.

5. Entre los varios procedimientos que conducen a la realización del citado cuerpo benzodiazepínico consideramos que el del objeto de esta Patente reúne las mayores ventajas en rendimiento así como en la obtención industrial por la sencillez de su procedimiento y lo lineal de su marcha.

10. Nuestro procedimiento consiste en partir del 2 oxiamino-acetilamido-5-cloro benzofenona (previamente obtenido a partir del 2 dibromo acetilamido-5-cloro-benzofenona) transformándolo por ciclación y deshidratación en 7 cloro-5-fenil-hidroxi 1,3 dihidro 24 1,4 benzodiazepin-2 ona.



20. Esta deshidratación con ciclación y formación del compuesto benzodiazepínico se realiza por calefacción de la solución del compuesto a cadena abierta en disolvente anhidro. Se puede aumentar el rendimiento añadiendo un deshidratante que desplace el equilibrio de reacción hacia la formación de benzodiazepinos.

25. Para una correcta interpretación se describe, a continuación, un caso de ejecución práctica, a título de ejemplo no limitativo.

EJEMPLO;- Se disuelven 15,22 gr. (0,05 moles) de 2 oxiamino-acetilamido 5 cloro benzofenona en 700 cc. de piridina y 100 cc. de tolueno y se calienta a reflujo por 15 horas.

30. Se concentra la masa de reacción destilando los di-



solventes que arrastran el agua formada en la reacción por formación de un acetropo.

5. Se forma el producto 7 cloro-5-fenil-3-hidroxi 1,3 dihidro-2H 1,4 benzodiazepin en vacío del disolvente y posterior extracción del 2 oxiaminoacetamido-5-benzofenona que no hubiera reaccionado con ácido mineral diluido. Queda una masa insoluble en agua constituida por 7 cloro-5-fenil-3-hidroxi 1,3 dihidro-2H 1,4 benzodiazepin-2-ona que se purifica por cristalización en alcohol. El producto cristalino así obtenido funde a 202-204° y sus análisis espectrofotométricos en solución metamólica presenta la siguiente absorción:

15.

$$E \begin{matrix} 1\% \\ 1 \text{ cm.} \end{matrix} = 229 \text{ m} = 1.270$$

20. Habiéndose descrito ampliamente la naturaleza del invento, así como su realización en la práctica, se hace constar que el mismo es susceptible de variaciones de detalle, sin que por ello se altere su principio fundamental que constituye la esencia de la invención.

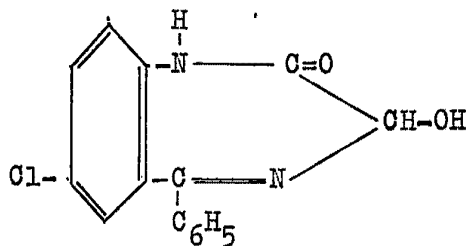
N O T A

Hecha la descripción del presente invento, se declaran como nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones:

25. 1ª.- Un procedimiento para la preparación de un producto benzodiazepínico, que posee la siguiente fórmula:



65



5.

o sea el 7-cloro-5-fenil-3-hidroxi-1,3-dihidro-2H-1,4-benzodiazepin-2-ona, caracterizado por partir de 2-oxiaminoacetilamido-5-cloro-benzofenona que por deshidratación se cicla dando el 7-cloro-5-fenil-3-hidroxi-1,3-dihidro-2H-1,4-benzodiazepin-2-ona.

10.

2ª.- Un procedimiento para la obtención de un compuesto benzodiazepínico, según la anterior reivindicación, en el que se realiza la deshidratación y ciclación del 2-oxiaminoacetilamido-5-cloro-benzofenona en disolvente anhidro por calefacción con procedimiento deshidratante.

15.

3ª.- UN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCIÓN DE UN PRODUCTO BENZOAZEPÍNICO.

Según se describe y reivindica en la presente Memoria descriptiva, que consta de cuatro hojas foliadas y escritas por una sola cara.

Madrid, a 10 de Agosto de mil novecientos sesenta y seis.

E. A.,  
Antonio Aridón  
P. P.