

22 AGO.



330731

P A T E N T E D E I N V E N C I Ó N

a favor de

los SRES. Dn. JOSE ANTONIO BOFILL AUGE - domiciliado en la calle Balmes, nº 294, BARCELONA y Dn. JOSE M<sup>o</sup> ESPINÓS TAYA - domiciliado en la calle Porvenir, nº 49, BARCELONA - ambos de nacionalidad española,

por :

"Procedimiento para la preparación de derivados pirazólicos".

-----:oOo:-----

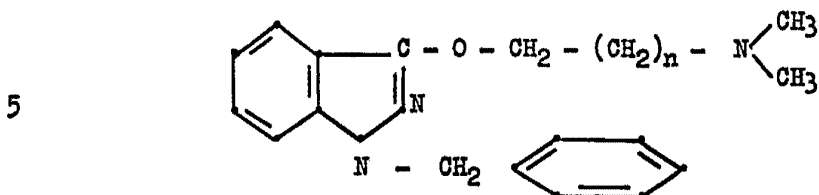
Memoria descriptiva

Esta patente tiene por objeto un nuevo procedimiento para la preparación de derivados pirazólicos, y más concretamente se re-

22 AGO.



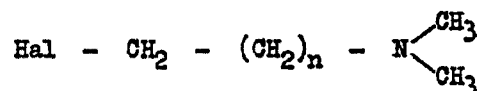
fiere a la obtención de derivados del benceno-pirazol (ó indazol) de fórmula general :



en la que n es un número entero comprendido entre 1 y 5.

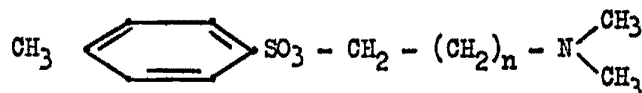
Esta serie de productos, entre los que se encuentra el 1-bencil-3-(3-dimetil-amino-propoxi)-1H-indazol (indazol ó benceno-pirazol), sustancia dotada de notables cualidades terapéuticas, se obtiene normalmente por reacción de la sal sódica del 1-bencil-3-oxi-1H-indazol (compuesto cuya preparación describió Milrath en 1908) con un derivado halogenado, de fórmula :

15



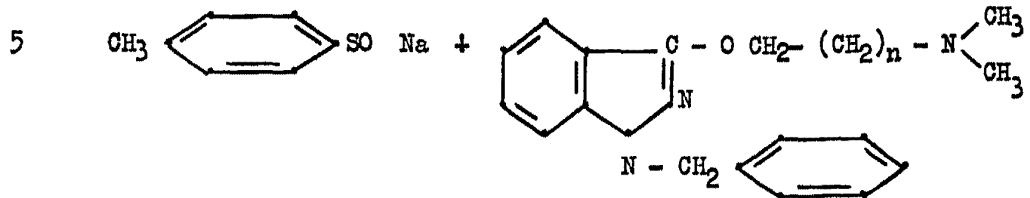
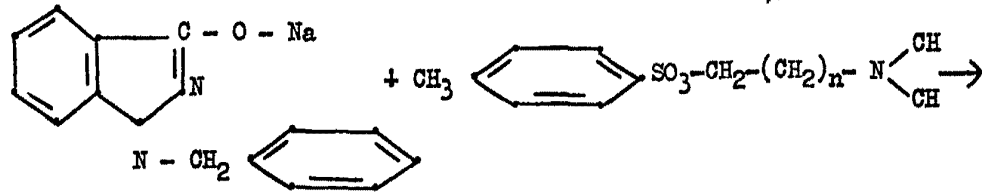
En el procedimiento objeto de esta patente se hace reaccionar en condiciones adecuadas la sal sódica del 1-bencil-3-oxi-1H-indazol, con un p-toluensulfonaté de fórmula general :

20

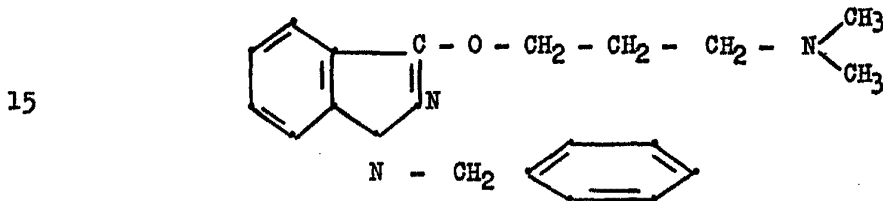


La reacción, que se realiza suspendiendo los productos reaccionantes en un disolvente orgánico no polar, tal como xileno, solo ó mezclado con éter etílico, transcurre según la siguiente expresión :

25



Para facilitar la comprensión de este procedimiento, y sin que ello pueda considerarse como limitación de la patente, se describe a continuación como ejemplo la preparación del 1-bencil-3-(3-dimetil-amino-propoxi)-1H-indazol, de fórmula :



EJEMPLO  
=====

Preparación de 1-bencil-3-(3-dimetilamino-propoxi)-1H-indazol.

A 400 ml. de metanol anhidro se añaden 4,6 gr. (0,2 mols) de sodio metálico y disueltos estos, 44,8 gr. (0,2 mols) de 1-bencil-3-oxi-1H-indazol. Con ello se obtiene una solución de la sal sódica de este producto, en metanol. Al vacío se lleva a sequedad; se recoge el sólido preparado y se tritura cuidadosamente. Se toman 24,6 gr. (0,1 mol) de esta sal y se suspenden en 250 ml. de xileno. A esta suspensión se añade, con fuerte agitación, y en el transcurso de unos treinta minutos, una solución de 26 gr. (0,1 mol) de p-toluensulfonato de α-dimetilamino-propilo en 150 ml. de éter dietílico. Se refluje durante unas cinco horas. Se enfría la mez-



22 AGO 1934

cla; se lava con agua, se deseca la capa xilénica y se destila, primero el disolvente y luego el aceite residual. Se recogen unos 26 gr. de líquido espeso que a un vacío de 0,5 mm. pasa a 197 °C.

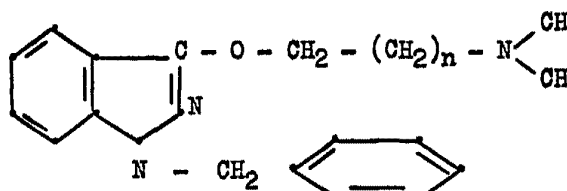
5

N O T A  
=====

Se reivindica como objeto de esta patente :

1. - Procedimiento para la preparación de derivados pirazólicos de fórmula general :

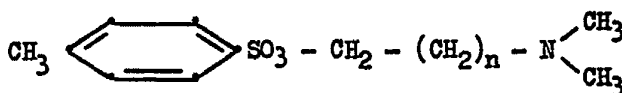
10



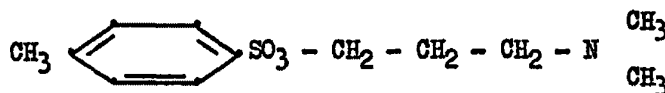
15

en la que n es un número entero comprendido entre 1 y 5, caracterizado por hacer reaccionar adecuadamente la sal sódica del l-bencil-3-oxi-1H-indazol, con un éster del ácido p-toluensulfónico, de fórmula general :

20



25



30

3. - Procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por realizar la reacción en un disolvente orgánico, generalmente no polar, en presencia ó ausencia de catalizadores, disolventes y diluyentes orgánicos ó inorgánicos.



4. - Procedimiento para la preparación de derivados pirazó-  
licos.

Esta memoria consta de cinco páginas, escritas por una sola  
cara.

BARCELONA,

22 AGO. 1900.

P. A.

JOAQUIN BOLIBAR  
P. P.