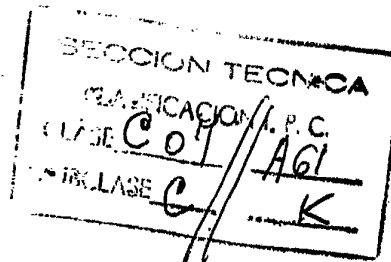


367815<sup>19</sup> MA



CERTIFICADO  
DE  
ADICIÓN

a favor de INSTITUTO DE INVESTIGACIONES TERAPÉUTICAS, S. A.,  
entidad española, domiciliada en Barcelona, calle Santany,  
20, por "MEJORAS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL  
Nº 347.509, por "PROCEDIMIENTO DE OBTENCIÓN DE UN DERIVA-  
DO DE ETILENDIAMINA".

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

El presente certificado de adición se refiere  
a unas mejoras aplicables en el objeto de la patente prin-  
cipal nº 347.509 en la que se cubre un nuevo procedimiento  
de obtención de un derivado de etilendiamina, así como a  
5. su certificado de adición Nº 352.077.

La citada patente principal tenía como objeto  
obtener un derivado de etilendiamina con uno de los ni-  
trógenos monosustituído por un radical cafeínico y otro  
disustituído por los radicales metilo y 2-fenilisopropi-  
10. lo.



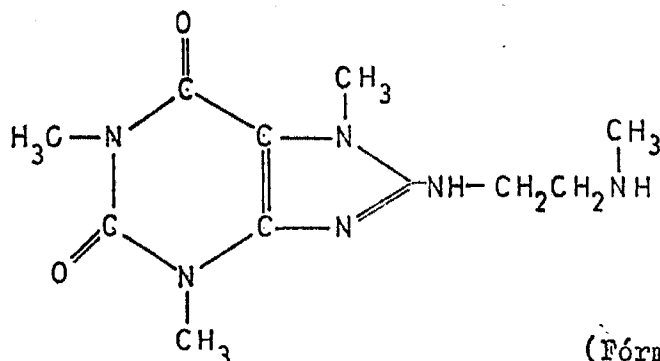
El resultado era un compuesto de fórmula  $C_{20}H_{28}N_6O_2$  de propiedades analépticas, psicotónicas, antidepresivas y antiespasmódicas, según se demostró experimentado con animales. Este compuesto fue el resultado de hacer reaccionar 8-haloxantinas con etilendiaminas substituídas.

Un nuevo procedimiento fue objeto de un certificado de adición en el que se preparaba el compuesto objeto de la patente principal haciendo reaccionar 8-(beta-cloroalquil)-aminocafeínas con aminas substituídas.

Las mejoras objeto de este segundo certificado de adición, proponen la obtención de un derivado de etilendiamina con análogas características y propiedades terapéuticas substituyendo los derivados xantínicos citados por N-[cafeino-(8)]-alquilendiaminas, que se harán reaccionar con halogenuros de alquilo.

El procedimiento mejorado consiste esencialmente en hacer reaccionar N-[cafeino-(8)]-alquilendiaminas con el halogenuro de alquilo correspondiente al derivado que se desee obtener.

Preferentemente, se lleva a cabo haciendo reaccionar N-metil-N-[cafeino-(8)]-etilendiamina





con bromuro de fenilisopropilo



Esta reacción debe llevarse a cabo en el seno de un disolvente orgánico y en presencia de una substancia captadora de haluro de hidrógeno, por ejemplo carbonato sódico anhidro.

5.

Para facilitar la comprensión de este invento se cita a continuación un ejemplo, dado a título informativo y no limitativo.

EJEMPLO

10.

Se refluje durante 8 horas 0,25 mol de N-metil-N-[cafeino-(8)-]etilendiamina con 0,25 mol de bromuro de fenilisopropilo en 700 cc de etanol junto con 0,14 mol de carbonato sódico anhídrido. Se filtra el producto precipitado en caliente, y de los líquidos, previa ligera concentración, se obtiene un derivado de punto de fusión de 153-55°C.

15.

Serán independientes del alcance de la invención las características accesorias empleadas en la puesta en práctica del procedimiento, tales como los medios y aparatos empleados para ello, por quedar todo ello comprendido en las siguientes reivindicaciones.

20.

- . -

N O T A



Se reivindica como objeto del presente certificado de adición :

5. 1. Mejoras en el objeto de la patente principal Nº 347.509, por "Procedimiento de obtención de un derivado de etilendiamina", caracterizados esencialmente por el hecho de hacer reaccionar N-[cafeino-(8)]-alquilendiaminas con el halogenuro de alquilo correspondiente al derivado que se desea obtener.
10. 2. Mejoras en el objeto de la patente principal Nº 347.509, por "Procedimiento de obtención de un derivado de etilendiamina", según la reivindicación 1, caracterizados por el hecho de hacer reaccionar N<sub>2</sub>-metil-N<sub>1</sub>-[cafeino-(8)]-etilendiamina con bromuro de fenilisopropilo.
15. 3. Mejoras en el objeto de la patente principal Nº 347.509 por "Procedimiento de obtención de un derivado de etilendiamina", según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizados por el hecho de llevar a cabo la reacción en el seno de un disolvente y de una substancia captadora de haluro de hidrógeno.
20. 4. Mejoras en el objeto de la patente principal Nº 347.509, por "Procedimiento de obtención de un derivado de etilendiamina.

Todo ello según queda escrito y reivindicado en



la presente memoria descriptiva que consta de cinco hojas  
foliadas escritas por una sola cara.

Barcelona, 19 de mayo de 1.969

INSTITUTO DE INVESTIGACIONES  
TERAPÉUTICAS, S. A.

p.a.

