



404946

17 JUL 1950

404946

Int. Cl.: C07D

P A T E N T E

D E

I N V E N C I O N

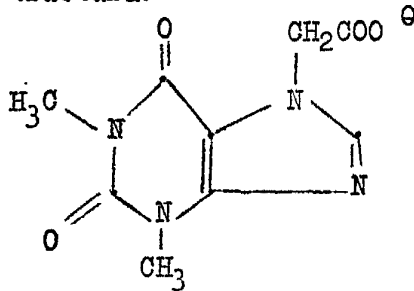
por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE TEOFILIN ACETATO DE 1-METIL-4-(5-DIBENZO(ALFA, EPSILON)CICLOHEPTATRIENILIDENO) PIPERIDINA", a favor de la firma española LABORATORIOS VIÑAS S.A., domiciliada en BARCELONA, Torrente Vidalet, 29.

= . =

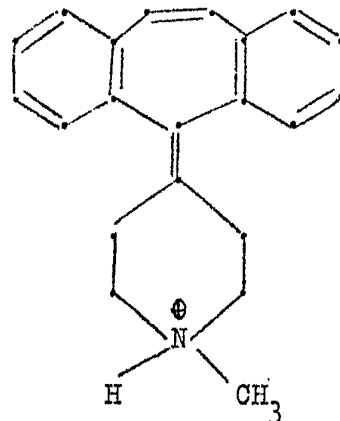
MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a una nueva sal de la 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, de la fórmula empírica $C_{30}H_{31}N_5O_4$ y con la estructura:

5.



10.





La sal de la invención se destina a usos industriales y farmacéuticos.

5. Mediante esta sal se consigue una mayor solubilidad y una mejora en las propiedades terapéuticas de la 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina.

Las propiedades físicas de la citada sal, objeto de la invención, responden a los siguientes valores:

10. Polvo, blanco, cristalino, con punto de fusión 122 - 127°C. Su solubilidad en agua es del orden de 1 gr./ml. a 20°C. Soluble totalmente en etanol, parcialmente soluble en acetona e insoluble en benceno.

15. El análisis químico elemental del teofilin acetato de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, obtenido según el procedimiento de la invención arroja los siguientes valores:

	<u>Calculado</u>	<u>Hallado</u>
C	65,21 %	65,1 %
H	6,16 %	6,2 %
20. N	12,68 %	12,7 %
O	15,95 %	16,0 %

25. La invención comprende su procedimiento de preparación, el cual consiste en hacer reaccionar una disolución alcohólica, preferentemente etanólica, de la 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, con una disolución acuosa del ácido teofilin acético, hasta alcanzar un pH entre 6 y 7, preferentemente 6,1. Recristalizando seguidamente, a la temperatura ambiente, el exceso de ácido teofilin acético agregado y, después de su filtrado,



evaporando a sequedad las aguas madres de la reacción.

Los ejemplos que siguen a continuación, se dan con carácter ilustrativo y no limitativo de la invención.

Ejemplo 1:

5. A una solución alcohólica al 25 % de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, se le va añadiendo ácido teofilin acético, en solución acuosa al 3%, hasta un pH de 6,1. Seguidamente se deja recrystalizar el exceso del ácido teofilin acético a la temperatura ambiente; finalmente se filtra, llevando a sequedad el filtrado. Se obtiene así el teofilin acetato de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, con un punto de fusión de 122 - 127°C.
- 10.

Ejemplo 2:

15. 28,739 gramos de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina se disuelven en 100 ml. de alcohol etílico y se añade gota a gota 23,820 gramos de ácido teofilin acético disuelto en 1.000 ml. de agua. Seguidamente se deja recrystalizar el exceso de ácido teofilin acético a la temperatura ambiente; finalmente se filtra, llevando a sequedad el filtrado. Se obtiene el teofilin acetato de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, con un punto de fusión de 122 - 127°C.
- 20.

25. La invención, dentro de su esencialidad, se puede llevar a la práctica en otras formas de realización que difieran en detalle de la expuesta en la descripción a título de ejemplo y a las cuales alcanzará las mismas ventajas que se desean obtener, por quedar todo ello comprendido en el espíritu de las reivindicaciones.

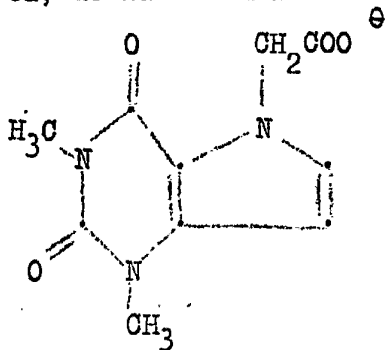


N O T A

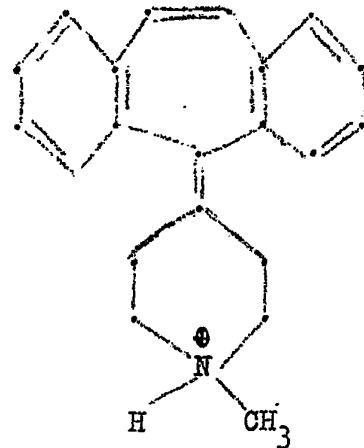
Descrito el objeto del presente invento, lo que se declara nuevo y de propia invención, comprende las reivindicaciones siguientes:

- 5. 1.- Procedimiento para la preparación de teofilin acetato de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, de aplicación industrial y farmacéutica, de la fórmula estructural

10.



15.



20.

caracterizado por hacerse reaccionar con una disolución alcohólica, preferentemente etanólica, conteniendo 20 a 30% de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)cicloheptatrienilideno) piperidina, una solución acuosa de ácido teofilin acético, a concentración comprendida entre 2 y 4 %, hasta que, en el seno de la reacción, se alcance un pH próximo a 6, dejando recristalizar a continuación el exceso de ácido teofilin acético no reaccionado a temperatura ambiente y filtrando

25.

2.- Procedimiento para la preparación de teofilin acetato de 1-metil-4-(5-dibenzo(alfa,épsilon)ciclohepta-

= 5 =

404946

17



trienilideno)piperidina.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de cinco hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

5.

Madrid, a 17 Julio 1972

p. a. JAIME ISERN

p. p.

Firmado: JOSE F. NIETO

mt.