

407586

14 APR 1955



P.- 52.227

Rehecha I

407586

MEMORIA DESCRIPTIVA

Int. Cl.: A61K, C07D

para solicitar PATENTE DE INVENCION

a nombre de LABORATORIOS MADE, S.A.

entidad española

con domicilio en Avenida de Burgos, Km. 5,850.-Madrid

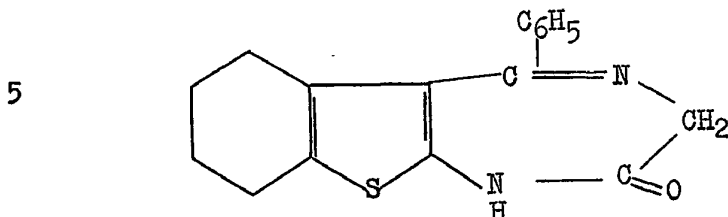
por: "UN METODO PARA LA OBTENCION INDUSTRIAL DE UN PRODUCTO TRANQUILIZANTE DERIVADO DE 2-(N-FTALIMIDOACETILAMINO)-3-BENZOL-4,5-TETRAMETILENTIOFENO"

(Clase Internacional C07d)

407586



El presente invento tiene por objeto un método para la obtención industrial de un producto tranquilizante de fórmula



10 y de sus derivados por adición de ácidos o bases, caracterizado por la hidrazinólisis de 2-(N-ftalimidacetilamino)-3-benzoil-4,5-tetrametilentiofeno, seguido de ciclación en un paso único lo que supone un considerable avance técnico sobre los métodos descritos para la obtención de este producto (P.Esp.nº 393101) ya que el mismo se obtiene con una pureza apta para su uso en humanos.

15

A continuación se pone un ejemplo, no limitativo del alcance del presente invento.

Ejemplo 1:

20 En un reactor de 100 l de capacidad, provisto de sistema de reflujo, agitador, boca de carga de sólidos y embudo de llave se ponen 3234 g de 2-(N-ftalimidacetilamino)-3-benzoil-4,5-tetrametilentiofeno, suspendidos en 40 l. de alcohol y se comienza a agitar. A continuación se agregan 440,3 g. de hidrato de hidracina al 80%,

25 y se calienta a reflujo, durante tres horas, manteniendo

407586

14



la agitación.

La hidrazida ftálica que se forma en la reacción se filtra en caliente y se deja toda la noche. A la mañana siguiente se filtra en frío y se destilan a la presión normal 35 l. de alcohol, (en este momento comienzan a formarse cristales), se deja enfriar y se filtra.

Las aguas madres se destilan hasta que comienzan a aparecer cristales, se deja enfriar y se filtra repitiendo el proceso dos veces. Los sólidos obtenidos se unen, siendo el rendimiento, en los diversos ensayos efectuados, superior al 90%.

Las constantes físicas de la 2,3-tetrametilen-4-fenil-7-oxo-tieno[2,3-f] diazepina se corresponden con las descritas en la Patente citada más arriba.

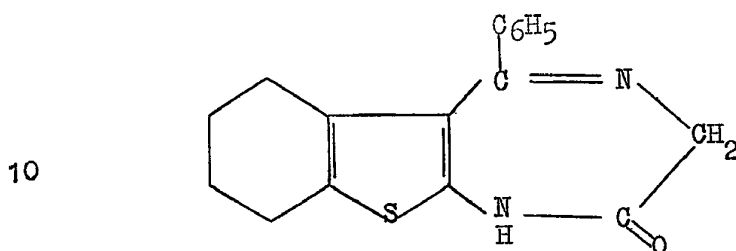
Por cromatografía en capa fina, utilizando placas prefabricadas Merck F<sub>254</sub>, aparece una única mancha a R<sub>f</sub>=0,63 (Benceno-Etanol 4:1).

- REIVINDICACIONES -

Los puntos de invención propia y nueva que se

presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

1ª.- Un método para la obtención industrial de un producto tranquilizante derivado de 2-(N-ftalimidoacetilamino)-3-benzoil-4,5-tetrametilentiofeno que tiene la fórmula:



y de sus derivados salinos por adición de ácidos o bases, caracterizado por la hidrazinólisis de 2-(N-ftalimidoacetilamino)-3-benzoil-4,5-tetrametilentiofeno, seguido de ciclación en un paso único, aislando por concentración y filtración un producto de pureza apta para su uso en humanos.

2ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la concentración y filtración se hacen en pasos sucesivos.

3ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la concentración del alcohol se lleva a cabo a la presión atmosférica.

4ª.- UN METODO PARA LA OBTENCION INDUSTRIAL DE

407586



UN PRODUCTO TRANQUILIZANTE DERIVADO DE 2-(N-FALIMIDOACE  
TILAMINO)-3-BENZOL-4,5-TETRAMETILENTIOFENO.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que an  
tecede y para los fines que se han especificado.


5 Esta Memoria consta de cinco hojas escritas a  
máquina por una sola cara.

Madrid,

P.A.

14 ABR. 1975

10

Alberto de Eizoburu  
Prof. Farm.  


9-4-75  
jul