

27



F.C. 10-3-76

COFD, AGIK

PATENTE
DE
INVENCION

427722

por "METODO PARA LA PREPARACION DE CODEINONA A PARTIR DE TEBAINA",
a favor de la firma FABRICA DE PRODUCTOS QUIMICOS Y FARMACEUTICOS
ABELLO, S.A., domiciliada en Madrid, calle de Vinaroz, nº 15.

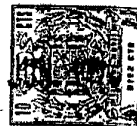
--oOo--

MEMORIA DESCRIPTIVA

El paso de la serie de la tebaina a la codeinona -
se puede realizar por diferentes vias y procedimientos.

Knorr y Hörlein por un lado y Schöpf y Hirsch por
otro, realizaron la hidrólisis de la tebaina en medio ácido
5. acuoso, obteniendo codeinona y metanol, pero en rendimientos
muy bajos.

El paso de la tebaina a la codeinona via 14-Bromo-
codeinona y neopinona fué también intentado por Conroy y --
Krausz pero el número de etapas requerido y el rendimiento -
10. en cada una de ellas hacen el método poco rentable.



Este proceso ha sido llevado a cabo con cierto éxito por diferentes autores como Gavard y col. y ha sido objeto de varias patentes.

Los rendimientos que se alcanzan oscilan del 50 al -

5. 75%.

En esta memoria se describe un procedimiento de transformación de Tebaina en Codeinona por tratamiento de aquella - con ácido bromhídrico en medio anhidro en presencia de un catalizador y la posterior hidrólisis del compuesto bromado así formado, en medio alcalino suave, a temperaturas de trabajo inferiores en todo momento a 10°C.

En este caso se han alcanzado rendimientos superiores al 95%.

Para ilustrar prácticamente la realización de la presente invención exponemos a continuación un ejemplo sin carácter limitativo.

Ejemplo: A un matraz de 3 litros provisto de agitación, termómetro y tubo de salida de gases con cloruro cálcico, que contiene una solución de 150 g. de ácido bromhídrico seco en 550 ml. de eter di-n-butílico, enfriado exteriormente a -15°C, se añade una solución de 2 g. de iodo disueltos en 100 ml. de cloruro de metileno seco, haciendo, a continuación descender la temperatura a -20°C.

Cuando se ha alcanzado esta temperatura se añade rápidamente sobre la solución anterior, con fuerte agitación, una solución de 100 g. de Tebaina (92,5% pureza) disueltos en 1.000 ml. de cloruro de metileno previamente enfriado a -15°C.

Por efecto de esta adición la temperatura sube a +10°C. Se baja a 0°C en poco tiempo, y manteniendo esta temperatura durante 7 minutos más.



Al cabo de este tiempo se vierte el contenido del matraz sobre un vaso de 5 litros que contiene una suspensión de 180 g. de bicarbonato sódico en 1.000 g. de agua y 450 g. de hielo, con fuerte agitación.

5. Se mantiene la agitación durante una hora. El producto de reacción se separa en dos capas. La acuosa se lleva a pH 8 con sosa diluida y se extrae tres veces con 200 ml. de cloruro de metileno. Este extracto se una a la capa orgánica anterior, se lava con agua y seca con sulfato sódico anhidro.
10. De la solución resultante se evapora el disolvente a vacío, hasta 1/100 de su volumen.
La codeinona, que precipita al concentrar la solución presenta un color rosa claro, se filtra y se lava con eter etílico.
15. Se obtuvieron 96 g. de codeinona de p.F. 165-7°C y 90,36% de contenido. Rendimiento 98% de la cantidad teórica.

N O T A

20. Hecha la descripción del presente invento lo que se declara como nuevo y de propia invención comprende las reivindicaciones siguientes:
 - 1.- Método para la preparación de codeinona a partir de tebaina, caracterizado por el hecho de hacer reaccionar, con la intervención de iodo como catalizador, tebaina disuelta en cloruro de metileno con ácido bromhídrico en eter di-n-butílico, en medio anhidro y a temperaturas inferiores a 10°C, con hidrólisis posterior del compuesto formado en medio alcalino suave de bicarbonato sódico, y posterior extracción con cloruro de metileno y obtención de la codeinona por evaporación del disolvente.
- 25.
- 30.

427722

21



Este método general se hace extensivo y engloba los -
casos concretos que derivan del empleo de diferentes ácidos --
halogenhídricos, como agentes halogenantes, diferentes compues-
tos clorados, para disolver la Tebaina y diferentes éteres para
5. disolver el ácido halogenhídrico.

2.- Un procedimiento de preparación de codeinona.

Según se describe y reivindica en la presenta memoria
que consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por una -
sola cara.

10.

Madrid, a 27 de Junio de 1.974.

FÁBRICA DE PRODUCTOS QUÍMICOS
Y FARMACEUTICOS ABELLÓ, S. A.


DIRECTOR GENERAL

