

433081

Int. Cl. C07D/A61K

MEMORIA DESCRIPTIVA

correspondiente a la solicitud de concesión de una

PATENTE DE INVENCION

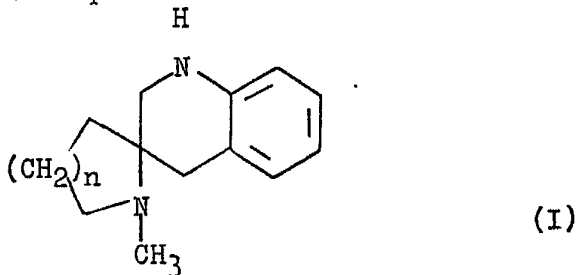
SOLICITANTE: HOKURIKU PHARMACEUTICAL CO., LTD.

RESIDENCIA: 1-Chome, 3-14, Tatekawacho, Katsuyamashi,
FUKUI, Japón.

ENUNCIADO: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE UN
COMPUESTO ESPIRO.

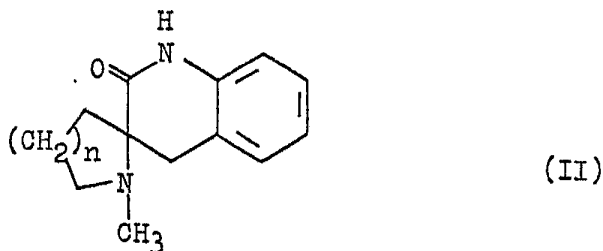
Prioridad: Patente japonesa nº 48-141178 del 19-12-73
l.a.

1 Esta invención se refiere a un nuevo compuesto espiro
que posee actividad farmacéutica y a un procedimiento para su
preparación. Más especialmente, esta invención se refiere a
un nuevo compuesto espiro de fórmula:



10 donde n es el número entero 1 ó 2 y a sus correspondientes
sales de adición de ácido, farmacéuticamente aceptables.

De acuerdo con esta invención, el compuesto de fórmula (I) puede ser preparado tratando un compuesto espiro de fórmula:



20 donde n es el definido anteriormente, con un agente reductor.
Puede emplearse hidruro de litio y aluminio como agente reductor
en este invento. Los disolventes preferidos son éter anhidro,
tetrahidrofurano, dioxano, etc. La reacción se lleva a
cabo preferiblemente a temperaturas próximas al punto de ebullición
25 del disolvente.

El producto de acuerdo con esta invención puede ser convertido,
con un ácido orgánico o inorgánico, en las correspondientes sales.
Son ejemplos específicos de los ácidos que pueden utilizarse el ácido
clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido oxálico, ácido cítrico, ácido
30 tartárico, ácido succínico,

1 etc.

El compuesto (I) producido de acuerdo con esta invención presenta actividad analgésica, anti-histamínica y espasmolítica y efectos sobre el aparato circulatorio. El compuesto (I) de esta invención es adecuado para uso como agente farmacéutico y es útil también como intermediario de otros agentes farmacéuticos.

Ahora será explicada la invención prácticamente mediante los siguientes ejemplos.

10

EJEMPLO 1

1',4'-Dihidro-1-metil-espiro [piperidin-2,3'(2'H)quinoleína]

15

A una suspensión de 0,1 g de LiAlH_4 en 10 ml de Et_2O se añade gota a gota una solución de 0,1 g de 1',4'-dihidro-1-metil-espiro-piperidin-2,3'(2'H)quinolein-2'-ona en Et_2O , con agitación y se calienta a reflujo durante 16 horas.

20

El exceso de LiAlH_4 se descompone con agua. Se decanta la capa etérea y la capa acuosa se extrae con Et_2O . Se combinan las capas etéreas, se lavan, se secan y evaporan. El producto obtenido se recristaliza en iso- Pr_2O , p.f. 89-90°C.

Análisis elemental para $\text{C}_{14}\text{H}_{20}\text{N}_2$:

Calculado : C, 77,73; H, 9,39; N, 12,95

Encontrado: C, 77,56; H, 9,37; N, 12,79

El siguiente compuesto se obtiene de forma similar.

25

i) 1',4'-dihidro-1-metil-espiro [pirrolidin-2,3'(2'H)quinoleína], p.f. 100-101° (iso- Pr_2O).

En resumen, la Patente de Invención que se solicita deberá recaer sobre las siguientes:

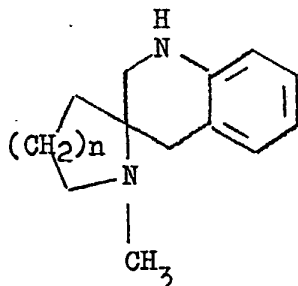
30

REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento de preparación de un compues-

1 to espiro de fórmula:

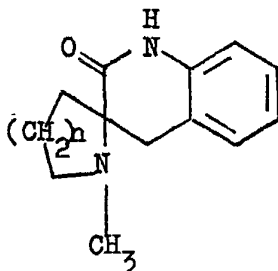
5



10

donde n es el número entero 1 ó 2 y las correspondientes sales farmacéuticamente aceptables, cuyo procedimiento consiste en reducir un compuesto espiro de fórmula:

15



donde n es el definido anteriormente y convertir el producto en las sales correspondientes.

20

2. Un procedimiento según la reivindicación 1, en el cual el producto obtenido es 1', 4'-dihidro-1-metil-espiro[piperidin-2,3'(2'H)-quinoleína].

25

3. Un procedimiento según la reivindicación 1, en el cual el producto obtenido es 1',4'-dihidro-1-metil-espiro[pirrolidin-2,3'-(2'H)quinoleína].

4. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la patente de invención que se solicita por: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE UN COMPUESTO ESPIRO.

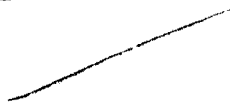
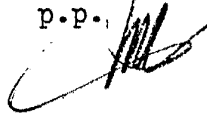
30

1 Todo conforme queda descrito y reivindicado en
la presente memoria descriptiva que consta de cinco páginas
mecanografiadas.

Madrid, 18 de diciembre de 1.974

5 BERNARDO UNGRIA

P.P.



10

15

20

25

30