



ESPAÑA

454.239

⑩ ES	⑪	NUMERO	⑬ A1
	⑫	454.239	
	⑭	FECHA DE PRESENTACION	
		11-12-76	

PATENTE DE INVENCION

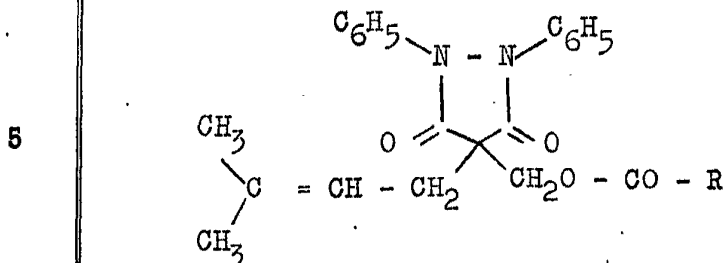
⑬ PRIORIDADES:		
⑮ NUMERO	⑯ FECHA	⑰ PAIS
⑲ FECHA DE PUBLICIDAD	⑳ CLASIFICACION INTERNACIONAL	㉑ PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	CO7D A61K	
㉒ TITULO DE LA INVENCION		
PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS DE 3,5-PIRAZILIDINDIONA.		
㉓ SOLICITANTE (ES)		
LABORATORIOS CUSI, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
MASNOU (Barcelona)		
㉔ INVENTOR (ES)		
D. PABLO ARIÑO MESTROJUAN, D. EDUARDO GUZMAN LLANSA y D. ENRIQUE MELENDEZ ANDREU, todos de nacionalidad española, los cuales han cedido sus derechos a la entidad solicitante.		
㉕ TITULAR (ES)		
㉖ REPRESENTANTE		
D. BERNARDO UNGRIA GOIBURU		

1 El Estatuto vigente sobre Propiedad Industrial, de
26 de Julio de 1929, en su texto refundido publicado el 30
de Abril de 1930, establece los caracteres de patentabili-
5 objeto obtener ventajas sobre lo ya conocido, admitiendo
por consiguiente como patentables, las nuevas máquinas, a-
paratos, instrumentos, procesos de fabricación, etc. La am
plitud de conceptos previstos como patentables, ha llevado
al legislador a aclarar (Artº. 46) que la enumeración con-
10 tenida en dicho cuerpo legal es puramente enunciativa y no
limitativa, haciéndola extensiva incluso a los descubrimien-
tos de tipo científico (Artº. 47).

El Decreto de 26 de Diciembre de 1947, recogiendo
la Orden de 18 de Noviembre de 1935, confirma el criterio
15 legal de que también serán patentables los instrumentos, ob
jetos, o partes de los mismos, que aporten a la función a
que son destinados, un beneficio o efecto nuevo, y en defi
nitiva que constituyan una mejora sustancial sobre lo ante
riormente conocido.

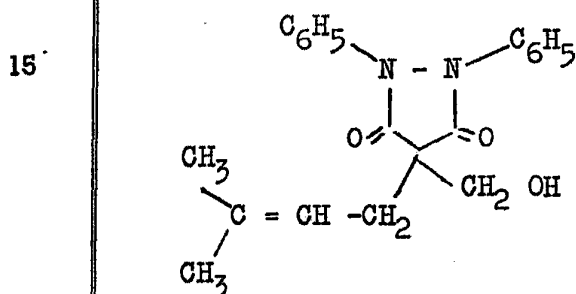
20 Pues bien, a tenor de lo expuesto, y en base al ar
ticulado que recoge los conceptos expresados, debe conside-
rarse, que la invención a que se refiere la presente memo-
ria, constituye una novedad industrial, con características
y ventajas que la hacen merecedora del privilegio de explo-
25 tación exclusiva que por ella se solicita, premiando así
los méritos de quien aporta a la industria del país una me-
jora efectiva y precisamente comprendida entre las enuncia-
das por la Ley como patentables. (Arts. 46 y 47 en relación
con el 171, en su nueva redacción afectada por la Orden de
30 18 de Noviembre de 1.935).

1 El objeto de la presente invención es la obtención de productos de fórmula (I)



10 donde R puede ser un radical alquilo lineal o ramificado, cicloalquilo, arilo, derivados β -ariaquenos y β -hetociclicalcuenos. Todos ellos pueden a su vez presentar sustituyentes de tipo halógeno, alquilo, carboxilo, nitro metoxi, etc.

Los compuestos de fórmula (I) se obtienen a partir del producto de fórmula (II)



20 y de diversos ácidos o sus especies reactivas en un disolvente orgánico seco.

CONDICIONES DE REACCION

25 La reacción puede efectuarse convenientemente formando una disolución o suspensión del compuesto de fórmula II en un medio orgánico aprótico seco y añadiendo una especie reactiva del ácido apropiado.

30 La reacción puede llevarse a cabo en presencia de un captador de halohídrico si la especie reactiva es un haluro de ácido. Cuando la especie reactiva es un anhídrido la reacción puede efectuarse convenientemente tanto en un disol

1 1 hora y se calienta a 40°C durante 4 horas.

5 Una vez frío se evapora a sequedad, se disuelve en cloroformo y esta solución se lava con carbonato sódico al 10 % y agua. La solución clorofórmica seca se evapora a sequedad y resulta un sólido espumoso que pesa 5,6 g. Este sólido se cromatografía a través de sílica gel, obteniéndose 2 g de producto puro en forma de aceite. Se disuelven en 10 cc de metanol y se gotean sobre 200 ml de salmuera fría. Se obtienen 1,9 g de sólido blanco de p. f. 67-69 °C.

10

EJEMPLO 2

β -(2-furil)acrilato de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 1,2-difenil, 4-hidroximetilo.

15

En un balón de 100 cc y tres bocas provisto de agitador, termómetro y embudo de adición se colocan 4,2 g de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 4-hidroximetil 1,2-difenil, 25 cc de dioxano y 1,68 cc de trietilamina. A la disolución resultante se agrega en 30 minutos 2,3 g del cloruro del ácido β -(2-furil) acrílico en 5 cc de dioxano. Finalizada la adición se mantiene tres horas a temperatura ambiente.

20

25

Se filtra y el filtrado se evapora a sequedad. El aceite resultante se disuelve en acetato de etilo y se lava con bicarbonato y agua. La solución de acetato de etilo seca se evapora a sequedad dando 4,2 g de sólido esponjoso. Este sólido se cromatografía a través de sílicagel obteniéndose 2,6 g de un aceite prácticamente puro, que se disuelve en 10 cc de metanol y se gotean sobre 200 cc de salmuera fría. Se obtienen 2,3 g de sólido blanco de p. f. 55-65°C.

30

EJEMPLO 3

2-Metoxicinamato de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil)

1 1,2-difenil, 4-hidroximetilo-

El procedimiento es el del Ejemplo 2, pero sustituyendo el cloruro de 2-nitrocina~~mo~~ilo por cloruro de 2-metoxicina~~mo~~ilo. p. f. 66-70°C.

5

EJEMPLO 4

3-Metilcinamato de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 1,2-difenil, 4-hidroximetilo.

El procedimiento es el Ejemplo 2, pero sustituyendo el cloruro de 2-nitrocina~~mo~~ilo por el cloruro de 3-metilcina~~mo~~moilo. p. f. 67-71°C.

10

EJEMPLO 5

p-Clorobenzoato de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 1,2-difenil, 4-hidroximetilo.

15

En un balón de 100 cc se colocan 23,8 g de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 4-hidroximetil, 1,2-difenil y 40 cc de piridina. La suspensión resultante se enfria en baño de hielo y se le agrega lentamente 13,1 g de cloruro de p-clorobenzoilo en 2,5 cc de dioxano. Finalizada la adición se mantiene la temperatura durante media hora y se continua la agitación 2 horas mas a temperatura ambiente.

20

Se concentra a sequedad y el sólido pastoso resultante se disuelve en cloroformo y se lava sucesivamente con clorhídrico 2 N, carbonato sódico al 10 % y agua. La solución clorofórmica seca se evapora a sequedad. Queda un aceite que cristaliza espontáneamente. Se recrystaliza de metanol. Resultan 28,5 g p. f. 101-102°C.

25

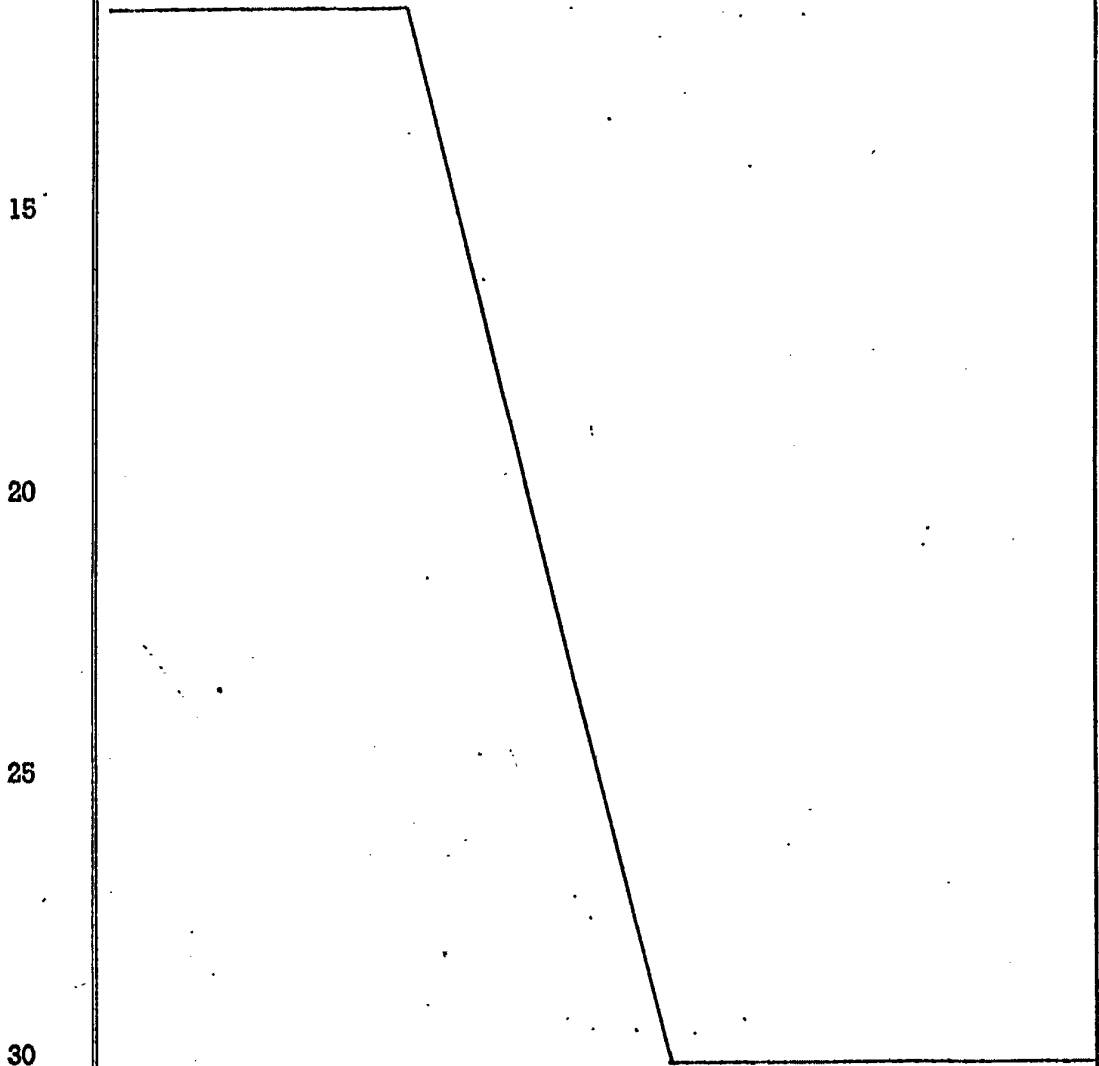
EJEMPLO 6

Hemisuccinato de 3,5-pirazolidindiona, 4-(3-metil-2-butenil) 1,2-difenil, 4-hidroximetilo.

30

En un balón de 100 cc se colocan 25 g de 3,5-pirazo

1 lidindiona, 4-(3-metil-2-butenil), 4-hidroximetil, 1,2-dife-
nil y 40 cc de piridina. A la suspensión resultante, enfria-
da a 0°C, se le agregan en porciones 10 g de anhídrido
5 succínico. Finalizada la adición se deja 24 horas agitándo-
se a temperatura ambiente y a continuación se calienta 6
horas a 50 °C. Se evapora a sequedad y al sólido resultante
se le añade agua y clorhídrico 2 N hasta pH ácido. Se agita
durante 30 minutos y se filtra. El sólido se recristaliza
de metanol. Resultan 30 g de sólido blanco de p. f. 150-152
10 °C.



1 Hecha la descripción a que se refiere la memoria
que antecede, es preciso insistir en que los detalles de
realización de la idea expuesta, pueden variar, es decir,
que pueden sufrir pequeñas alteraciones, basadas siempre
5 en los principios fundamentales de la idea, que son en esen-
cia los que quedan reflejados en los párrafos de la descrip-
ción hecha. En efecto, el Artículo 48 del Estatuto vigente
sobre Propiedad Industrial, establece como no patentables,
en su apartado tercero, "los cambios de forma, dimensiones,
10 proporciones y materias de un objeto ya patentado" fijando
así el criterio del legislador en el sentido de que paten-
tada una idea que pueda dar lugar a una realidad práctica
e industrializable, nadie podrá apoyarse en ella para, a
pretexto de haber introducido ligeras modificaciones, pre-
15 sentarla como nueva y propia.

Este principio, en cuanto al alcance de la protec-
ción del objeto patentado se refiere, se halla confirmado
por numerosas Sentencias del Tribunal Supremo, y entre -
ellas, como más terminantes, en las de fechas 16 de octubre
20 de 1954, 23 de enero de 1959, 20 de marzo de 1964 y otras.

Establecido el concepto expresado, en cuanto a la
amplitud que debe darse a la protección solicitada, se re-
dacta a continuación la Nota de Reivindicaciones, de acuer-
do con lo que se establece en el último párrafo del apar-
25 tado tercero del Artículo 100 de la Ley, sintetizando así
las novedades que se desean reivindicar:

NOTA DE REIVINDICACIONES

En resumen, el privilegio de explotación exclusi-
va que se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones si-
30 guientes:



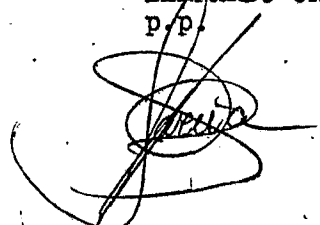
1 te orgánico aprótico y en presencia de un captador de ha-
lohídrico.

3. PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS
DE 3,5-PIRAZOLIDINDIONA, según la reivindicación 1, donde
5 X es RCOO- y la reacción se lleva a cabo en un disolvente
orgánico aprótico.

4. Se reivindica por último como objeto sobre el
que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita:
10 PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS DE 3,5-PIRA-
ZOLIDINDIONA.

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

Madrid 14 de diciembre de 1976
BERNARDO UNGRIA
P.P.



15

20

25

30

