



10 ES	11 NUMERO 458042	10 A1
21	22 FECHA DE PRESENTACION 6 de abril 1977	

458042

PATENTE DE INVENCION

50 PRIORIDADES:		
51 NUMERO	52 FECHA	53 PAIS
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D//A61K	52 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
54 TITULO DE LA INVENCION "Nuevo procedimiento para la sintesis de la 1-ciano-2-metil-3-(2((5-metil-imidazol-4-il-)metil)tio)etil)-guanidina".		
71 SOLICITANTE (S) RICORVI, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE 28, calle Llusa, BARCELONA-14 ESPAÑA		
72 INVENTOR (ES) Giorgio BRUZZI Josep A.CANICIO CHIMENO Francisco Javier VILA PAHI		
73 TITULAR (ES)		
74 REPRESENTANTE D.Pedro SUGRAÑES FERRER, Agte.Of.Prop.Ind. BARCELONA - c/.Provenza, 304		

UNE A - 4 MOD. 3106

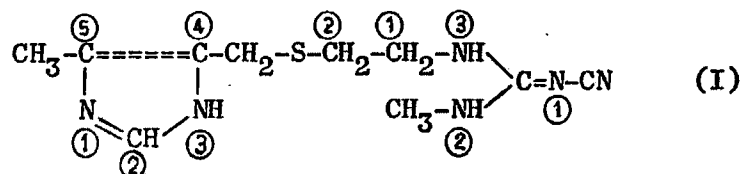
Concedido el Registro de acuerdo con los datos que figuran en la presente descripción y según el contenido de la Memoria adjunta. OTULICESE COMO PRIMERA PAGINA DE LA MEMORIA

20 JUL. 1978



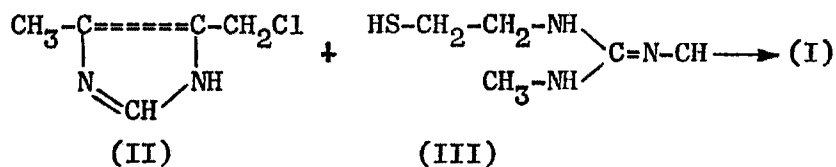
MEMORIA DESCRIPTIVA

El objeto de la presente invención es un nuevo procedimiento que permite la obtención a escala industrial de la 1-ciano-2-metil-3-(2-(((5-metil-imidazol-4-il)-metil)tio)etil)-guanidina, cuya fórmula de estructura es:



Este producto posee interesantes aplicaciones terapéuticas, como inhibidor de los mecanismos de producción de la úlcera gástrica.

El nuevo procedimiento desarrollado en los laboratorios de investigación de la Peticionaria, se caracteriza por la reacción entre el 4-clorometil-5-metil-imidazol (II) y el intermedio 1-ciano-2-metil-3-((2-tiol)etil)-guanidina (III) en medio alcalino, en forma de sal de tiol:



El derivado imidazólico (II) es un producto conocido, descrito en 1948 por H. Erlenmeyer (Helvética Chimica Acta-Tomo 31-Pag 33.1948) resultando fácilmente asequible según se describe en la bibliografía citada. Por contra, el

intermedio (III) es un producto nuevo, que ha sido sintetizado por primera vez por la Peticionaria.

A modo de ejemplo, que en ningún caso debe atribuírsele carácter limitativo, se indica a continuación un modo práctico de realización del invento.

Ejemplo

Se introducen en un matraz 0.5 mols de 4-clorometil-5-metilimidazol, 4 partes en peso de dimetilformamida y 1.0 mols de metóxido sódico. Se agita durante unos veinte minutos y se añaden 0,5 mols de 1-ciano-2-metil-3-((2-tiol)etil)guanidina. Se calienta a 70° durante 3 horas, se elimina la dimetilformamida a presión reducida y se añade agua. Se controla el pH hasta 8.8 y se filtra. El sólido filtrado se recristaliza de isopropanol.

Datos analíticos: Punto de fusión: 140-142° C.

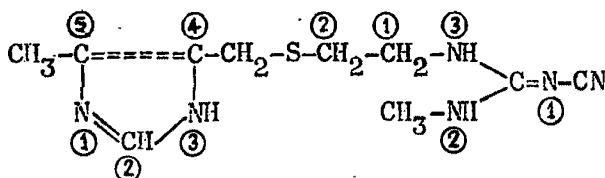
c.c.f. propanol-agua 7/3 : una mancha

En la ejecución práctica del objeto de la presente patente de invención, podrán variar cuantos detalles no afecten a su esencialidad.

REIVINDICACIONES

Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

1º.- Nuevo procedimiento para la síntesis de la
5 1-ciano-2-metil-3-(2-(((5-metil-imidazol-4-il-)metil)tio)etil)-
-guanidina, cuya fórmula de estructura es



10. caracterizado por hacer reaccionar el 4-clorometil-5-metil-
-imidazol con el 1-ciano-2-metil-3-((2-tiol)etil)-guanidina
en medio alcalino, en forma de sal de tiol.

2º.- NUEVO PROCEDIMIENTO PARA LA SINTESIS DE LA
1-CIANO-2-METIL-3-(2-(((5-METIL-IMIDAZOL-4-IL-)METIL)TIO)ETIL)-
-GUANIDINA.

15 Consta la presente memoria de tres hojas folia-
das y mecanografiadas por una sola cara.

Barcelona, 6 de abril de 1977

RICORVI, S.A.

p.a.