

COMUNICACION

ES
11
21
22

NUMERO	458.835
FECHA DE PRESENTACION	16-5-1977

10 A 1



26FH

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:	32 FECHA	33 PAIS
31 NUMERO		

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	CO7D	

54 TITULO DE LA INVENCION
"PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR 5-n-PROPILOTIOBENCIMIDAZOLCARBAMATO DE METILO"

71 SOLICITANTE (S)
SMITHKLINE CORPORATION (Casell)

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
1500 Spring Garden Street, Filadelfia, Pensilvania 19101, Estados Unidos de América

72 INVENTOR (ES)
Arnold Jakob Krog y Roger Cook Parish

73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
DON ALBERTO DE ELZABURU MARQUEZ (P-65.858)

TGG.

1 Se ha encontrado que el 5-propiltio-2-benci-
midazolcarbamato de metilo es un agente antiparasitario po-
tente, en animales. Es eficaz contra una amplia variedad de
helminos gastrointestinales tales como lombrices y tenias.

5 Las dosis habituales para administración oral están compren-
didas entre 1 y 15 mg/kg, en especial entre 2 y 8 mg/kg, en
ganado ovino y ganado vacuno. Entre los muchos parásitos es-
pecíficos susceptibles al compuesto químico se encuentran
Haemonchus, Nematodirus, Dictyocaulus y Moniezia.

10 Se ha encontrado ahora un nuevo procedimien-
to químico de preparación del 5-propiltio-2-bencimidazolcar-
bamato de metilo con rendimiento elevado. El procedimiento
comprende hacer reaccionar 4-propiltio-o-fenilendiamina con
N,N'-dicarbometoxi-2-metil-2-tiopseudourea, o bien en canti-
15 dades equimolares o con un ligero exceso de la tiourea, en
un disolvente o combinación de disolventes inertes en los
que los reactivos son solubles, a temperaturas comprendidas
entre la temperatura ambiente y el punto de ebullición de
la mezcla de reacción, hasta que la reacción es completa.

20 Los más útiles como disolventes son el agua, el cloruro de
metileno, el ácido acético y los alcoholes inferiores tales
como metanol, etanol o isopropanol. En estos disolventes
la reacción se lleva a cabo del modo más conveniente a la
temperatura de reflujo durante un periodo comprendido entre
25 1 y 12 horas.

También pueden ser usados otros disolventes
orgánicos. La fenilendiamina se usa preferiblemente en for-
ma de base, frecuentemente cruda, en la mezcla de reacción,
procedente de la reducción de la nitroamina correspondiente
30 a partir de la cual se prepara con frecuencia. Pueden usar-

1 se sales de adición de ácido de la fenilendiamina con modificaciones de disolvente apropiadas, pero la base se considera más útil.

5 El producto deseado se aísla por enfriamiento y reducción de volumen si es necesario. Con frecuencia el producto después de lavar con agua y disolvente orgánico, es bastante puro y se recupera con rendimientos excelentes comprendidos entre 80 y 90%.

EJEMPLO 1

10 Una mezcla de 18,23 g (0,10 moles) de 4-propiltio-p-fenilendiamina y 22,7 g (0,11 moles) de N,N'-dicarbometoxi-2-metil-2-tiopseudourea en 150 ml de etanol, se calentó a reflujo durante la noche con agitación. La mezcla se enfrió y el producto separado se lavó con agua (2 x 100
15 ml), etanol (2 x 50) y acetona (2 x 25 ml) obteniéndose 22,5 g de 5-n-propiltiobencimidazolcarbamato de metilo.

20

REIVINDICACIONES

25

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:

30

1^a.- Procedimiento para preparar 5-n-propil

1 tiobencimidazolcarbamato de metilo, que comprende hacer reac
cionar 4-propiltio-o-fenilendiamina con N,N'-dicarbometoxi-
-2-metil-2-tiopseudourea.

2^a.- "PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR 5-n-PROPI-
5 TIOBENCIMIDAZOLCARBAMATO DE METILO".

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

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

10

Madrid, 08. JUN 1977

P.A. Alberto de Elizburu
Por Poder.

15

20

25