

233170



233170

PATENTE DE INVENCION

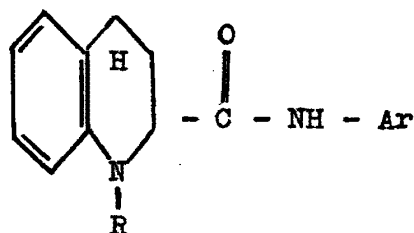
por 20 años

por "UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE AMIDAS DEL ACIDO N-ALQUIL-TETRAHIDROQUINALDINICO", a favor de Aktiebolaget Bofors, de nacionalidad sueca, domiciliada en Bofors (Suecia). Con prioridad de la Patente sueca nº 434/1956, presentada en 18 de enero de 1956.

=====

MEMORIA DESCRIPTIVA

El presente invento se refiere a un procedimiento para la preparación de amidas del ácido N-alkil-tetrahydroquinaldínico, según la fórmula



233170



5. En esta fórmula, R designa un grupo alquilo, y Ar un anillo bencénico 2 ó 2.6 substituído, en que los substituyentes son grupos alquilo.

10. Estas nuevas amidas han demostrado ser muy buenos anestésicos locales, con buena acción anestésica superficial. En cuanto a toxicidad, los efectos son más ventajosos que en la procaína.

15. Las amidas en cuestión pueden prepararse por un procedimiento que en sí es conocido, por la reacción entre derivados del ácido tetrahydroquinaldínico y aminas aromáticas, entre ácido tetrahydroquinaldínico e isocianato de aminas aromáticas o por hidratación de amidas aromáticas de ácido quinaldínico. Finalmente, el hidrógeno unido al átomo de nitrógeno se substituye por un grupo alquilo, convirtiéndose luego las bases obtenidas en sales, preferiblemente clorhidratos. Las amidas en cuestión pueden también prepararse por la síntesis de Grignard. La preparación se ilustra mediante los siguientes ejemplos.

Ejemplo 1:

25. Por reacción de 191.5 partes en peso de cloruro de quinaldilo con 121 partes en peso de 2.6 dimetilánilina en 500 partes en peso de tolueno seco, primeramente a temperatura ambiente y luego a 80° durante una hora, se obtiene un rendimiento casi cuantitativo de quinaldíl 2.6.dimetil xilidida. Por reducción de este compuesto en ácido acético mediante hidrógeno gas en presencia de
30. óxido de platino a 5 atm de presión y 80°C se obtiene tetrahydroquinaldíl-2.6-dimetil xilidida. Por alquilación mediante dimetil sulfato se obtiene N-metil-tetrahydroquinaldíl-2.6-dimetil xilidida.

233 170



Ejemplo 2:

35. Por reacción de 191,5 partes en peso de cloruro de quinaldilo con 121 partes en peso de 2-etilanilina y tratamiento según ej. 1, seguido de alquilación con dietil-sulfato se obtiene N-etil-tetrahydroquinaldil-2-etil anilida.

40. Ejemplo 3:

Por reacción de 191,5 partes en peso de cloruro de quinaldilo con 121 partes en peso de 2,6-dimetilanilina y tratamiento según ej. 1, seguido de alquilación con bromuro de n-butilo, se obtiene N-n-butyl-tetrahydroquinaldil-2,6-dimetil anilida.

45.

Ejemplo 4:

209,5 partes en peso de cloruro de N-metil-tetraquinaldilo se unen primeramente a 125 partes en peso de 2,6-dimetilanilina en 500 partes en peso de benceno, primeramente bajo refrigeración y luego calentando y a ebullición durante 1 hora. El clorhidrato de N-metil-tetrahydroquinaldil-2,6-dimetil-anilida así formado cristaliza, se separa por filtrado, se lava y se purifica por reprecipitación.

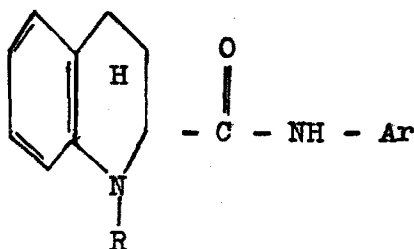
50.

55. Todo cuanto no afecte, altere, cambie o modifique la esencia del procedimiento descrito, será variable a los efectos de la actual Patente.

N O T A.

60. Se reivindica como objeto de esta Patente de invención:

1. - Un procedimiento para la preparación de amidas del ácido N-alkyl-tetrahydroquinaldínico, de fórmula general:



233170

65. en la que R designa un grupo alquilo y Ar un 2-alquil ó 2,6-dialquil benceno, caracterizado por la reacción de una amida o derivado del ácido tetrahydroquinaldínico con una amina aromática de fórmula general  $H_2NAr$  o un isocianato de ella, o por la hidratación de una amida de ácido quinaldínico.

70. Sean cuales fueren las circunstancias que concurren con la esencialidad de la Patente de invención definida en la anterior reivindicación, cual objeto es:

2. - "UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE AMIDAS DEL ACIDO N-ALQUIL-TETRAHIDROQUINALDINICO".

75. Consta la presente memoria de cuatro hojas foliadas, mecanografiadas por una sola cara.

Barcelona, catorce de enero de mil novecientos cincuenta y siete.

P.A. de Aktiebolaget Bofors,

L. DURÁN  
P. P.