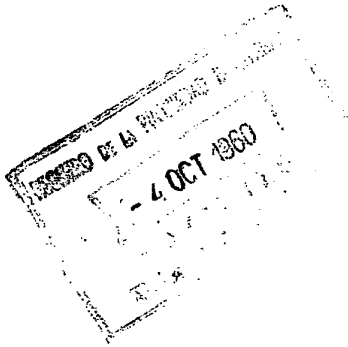


C.G.



261465



- 1 -

261465

Memoria Descriptiva

para

una patente de Invención
por veinte años en España

a favor de la r.s.

LEPETIT S.p.A.

- sociedad italiana -

residente en

MILANO (Italia)

Via Roberto Lepetit, 10

por:

" PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR α -(3,3-dimetil-1-acetidil)-
2,6-dimetilacetanilida "

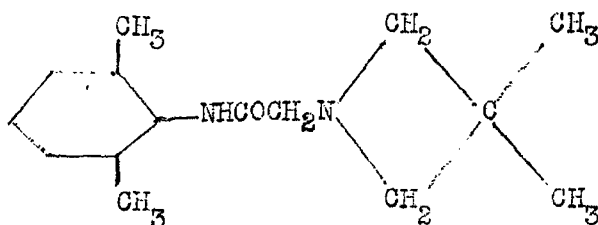
=====
Prioridad de solicitud patente italiana nº 17025 del día 14
de Octubre de 1959.

=====
INVENTOR: Emilio Testa, de nacionalidad italiana.
=====



261465

El presente invento se refiere a un nuevo agente terapéutico. Más particularmente el compuesto del invento es α - (3,3-dimetil-1-acetidil)-2,6-dimetilacetanilida de la fórmula



El nuevo compuesto se ha encontrado como altamente eficaz para anestésico local. Su actividad ha demostrado ser más alta que la de cocaína y lidocaina y su toxicidad es suficientemente baja para permitir su administración inocua al hombre.

10

La siguiente tabla da los resultados de una comparación entre dosis isodinámicas de α - (3,3-dimetil-1-acetidil)-2,6-dimetilacetanilida (DAD) y de lidocaina en experimentos realizados sobre animales.

15

Tabla

	Dosis y concentraciones isodinámicas.		Proporción Lidocaina/DAD
	Lidocaina	DAD	
Anestesia superficial (conejo)	1%	0.25%	4
Anestesia de infiltración (cobayo)	1%	$\geq 0.25\%$	≤ 4

20



Tabla

261465

	Dosis y concentraciones isodinámicas.		Proporción	
	Lidocaina	DAD	Lidocaina/DAD	
5	Anestesia en bloque (cobayo)	6.15%	2.63%	2.11
	Anestesia extradural lombo-sacral (rana)	2%	0.5%	~4
10	Anestesia de transmisión neural (sciatic-gastrocnemius, rana)	0.5%	0.2%	2.5

El producto se utiliza preferentemente en la forma de sales de adición con ácidos minerales no tóxicos.

15 Las dosis se varían de acuerdo con el efecto deseado. En todo caso, estas dosis son mucho más bajas que las correspondientes dosis de lidocaina.

20 El procedimiento para preparar el nuevo compuesto comprende el añadir gradualmente al hidrocloreto de una 3,3-dimetilacetidina una cantidad equimolecular de α -cloraceto-2,6-xilidida en presencia de un exceso por encima de dos equivalentes y preferentemente 3-5 equivalentes, de una amina alifática terciaria, tal como trietilamina, en un disolvente orgánico inerte. La solución se calienta después a 50-80°C, se filtra, se quita el disolvente y el residuo se destila en vacío.

25 El siguiente ejemplo es ilustrativo del invento.

4.-



EJEMPLO

261465

A una solución de 41 g. de hidrocioruro de 3,3-dimetilacetidina y 93 g. de trietilamina en 400 ml. de benceno anhidro se añaden gradualmente agitando a la temperatura ambiente 60 g. de α -cloroaceto-2,6-xilidida. La solución se calienta después a alrededor de 70°C durante 5 horas, se filtra y evapora hasta la sequedad. El residuo se destila y recoge a 175-185°C/0.5 mm. Punto de fusión 93-95°. Rendimiento 55 g. Hidrocioruro: punto de fusión 195-197°.

5

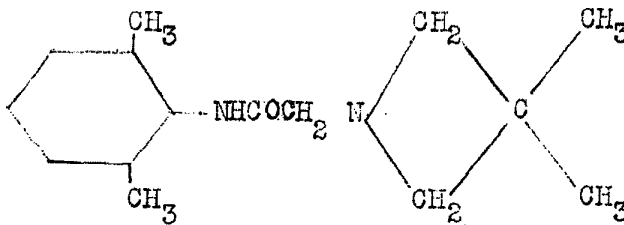


N O T A.-
 =====

261465

La presente patente de Invención comprende las siguientes reivindicaciones:

1.- Procedimiento para preparar α - (3,3-dimetil-1-acetidil)-2,6-dimetilacetanilida, de la fórmula



caracterizado porque comprende el añadir gradualmente un equivalente molar de α -cloroaceto-2,6-xilidida al hidrocioruro de 3,3-dimetilacetidina en presencia de un exceso por encima de dos equivalentes de una amina terciaria alifática en un disolvente orgánico inerte, calentando la mezcla a una temperatura de 50 a 80°, filtrando, separando el disolvente y destilando el residuo en vacío.

2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque la amina alifática terciaria es trietilamina.

3.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente orgánico inerte es benceno.

4.- Procedimiento para preparar α -(3,3-dimetil-1-acetidil)-2,6-dimetilacetanilida.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva. Y que consta de seis hojas foliadas

6.-



261465

y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 4 de Octubre de 1960.