

10 MAR. 1975

CONCEDIDA

In. Cl.: C07D/A61H

411061

PATENTE DE INVENCION

a favor de

LABORATORIO FARMACEUTICO QUIMICO-LAFARQUIM, S.A. de naciona
lidad española, residente en Madrid, Avda. de Aragón, 18,
por: "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DE BEN
CIMIDAZOL".

Memoria descriptiva

El núcleo de bencimidazol es interesante por sus
propiedades farmacológicas. Diversos derivados de este com-
puesto poseen actividad como antivirésicos, radioprotectores,
analgésicos, antiinflamatorios y antialérgicos, entre otras.

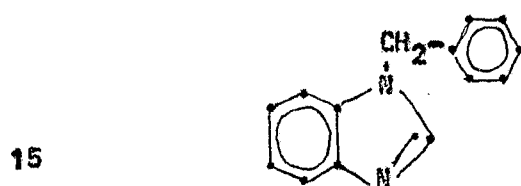
5

También se han descrito algunas como estimulantes
inespecíficos de las defensas del organismo por su acción

POOR
QUALITY

sobre el sistema retículo endotelial. Esta acción podría ser considerada como fundamental y base de las otras acciones descritas.

10 El objeto de la presente invención, es un derivado sencillo de bencimidazol, el 1-bencilbencimidazol, de fórmula:



el cual está dotado de cierta actividad sobre el sistema retículoendotelial.

20 A continuación damos ejemplos a título ilustrativo del procedimiento de obtención.

Ejemplo 1.

25 Una mezcla de 11,8 g. (0,1 mol) de bencimidazol, 12,6 g. (0,1 mol) de cloruro de bencilo y 6 g. de KOH se refluxa en 100 ml. de etanol absoluto durante 9 horas. La mezcla reaccionante se deja una noche en reposo a temperatura ambiente. El KCl se separa por filtración y la solución filtrada se vierte sobre 300 ml. de agua fría. Aparece un sólido, que se filtra a vacío, lava con agua y se seca al aire.

Se recristaliza en alcohol/agua (1/1 vol.)

30 Se obtienen unos 15 g de 1-bencil bencimidazol (base puro.

PF.- 112 - 115° C.

Ejemplo 2.

20,8 g. (0,1 mol) de 1-bencilbencimidazol se disuel
35 van en 110 ml. de solución 1N de ácido clorhídrico. Se deco-
lora la solución con carbón activo y el 1-bencilbencimidazol
clorhidrato se obtiene como un sólido blanco, no higroscópico
por evaporación de la solución decolorada, atomización o lio-
filización.

40 Ejemplo 3.

20,8 g. (0,1 mol) de 1-bencilbencimidazol se disuel
van en 110 ml. de solución 1N de ácido clorhídrico en etanol.
Se decolora la solución con carbón activo y se vierte lenta-
mente, agitando, sobre 500 ml. de éter sulfúrico. El sólido
45 que cristaliza, después de unas horas en nevera se filtra a
vacío y se lava con éter sulfúrico. Se seca al aire.

Ejemplo 4.

Esencialmente es como el ejemplo 3. La solución al-
cohólica decolorada, se evapora a vacío, obteniéndose así el
50 clorhidrato, de 1-bencilbencimidazol.

R E I V I N D I C A C I O N E S
=====

1). Procedimiento de obtención de un nuevo derivado de benci
midazol, caracterizado porque los productos reaccionantes son
bencimidazol y cloruro de bencilo, en medio potasa alcohólica,
55 obteniéndose como productos de reacción 1-bencilbencimidazol
y cloruro potásico.

- 2). Procedimiento de obtención de un nuevo derivado de benci
midazol, caracterizado porque los productos reaccionantes
son 1-bencilbencimidazol, obtenido según la reivindicación
60 1), y ácido clorhídrico acuoso, obteniéndose como producto de
reacción hidrocioruro de 1-bencilbencimidazol, aislándose el
producto por evaporación a vacío, atomización o liofilización.
- 3). Procedimiento de obtención de un nuevo derivado de benci
midazol, caracterizado porque los productos reaccionantes
65 son 1-bencilbencimidazol, obtenido según la reivindicación 1),
y ácido clorhídrico alcohólico, obteniéndose como producto
de reacción hidrocioruro de 1-bencilbencimidazol, aislándose
el producto por evaporación a vacío o precipitación con éter
sulfúrico u otro disolvente poco polar.
- 70 4). "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO DERIVADO DE BENCI
MIDAZOL".

Esta Memoria consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por un solo lado de sus caras.

Madrid, 27 de enero de 1973

