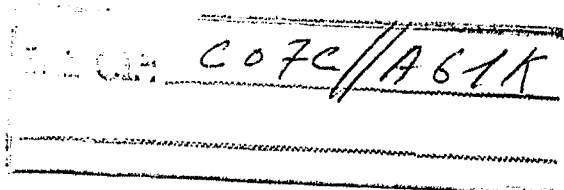


429843

22 OCT 1974

P.- 58.417

102



MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar PATENTE DE INVENCION

a nombre de SOCIETE D'ETUDES SCIENTIFIQUES ET  
INDUSTRIELLES DE L'ILE-DE-FRANCE

Sociedad anónima francesa

establecida en 46, boulevard de Latour-Maubourg, 75-París  
7<sup>e</sup>, Francia

por: "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE N-(DIETILAMINOETIL)-  
-2-METOXI-5-METILSULFONILBENZAMIDA"  
(Clase Internacional CO7c)

17.10.74

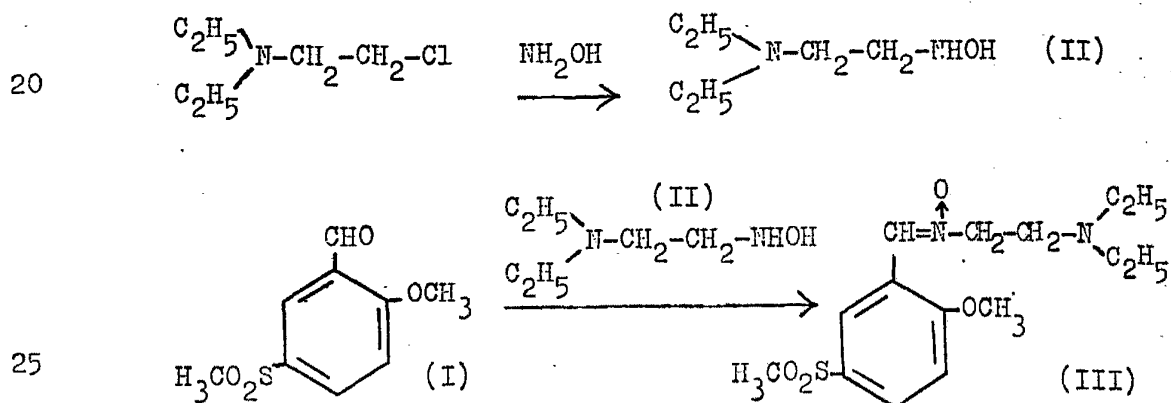
- 1 -

La presente invención se refiere a un nuevo procedimiento de preparación de N-(dietilaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida (IV), de sus sales de adición con ácidos minerales u orgánicos farmacéu-  
 5 ticamente aceptables, y de las sales de amonio cuaternarias obtenidas haciendo reaccionar esta benzamida (IV) con un agente de alcoholación.

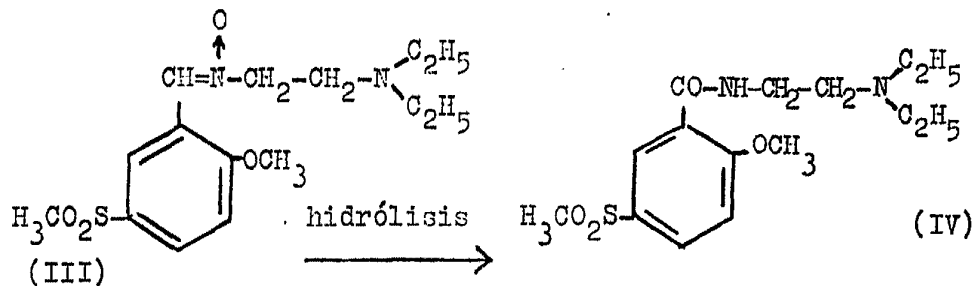
La benzamida (IV) se obtiene tratando 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehído (I) con N,N-dietilaminoetil hidroxilamina (II), de modo que se obtiene 2-metoxi-5-me-  
 10 tilsulfonilbenzaldehído-(N,N-dietilaminoetil)nitrona (III), que se hidroliza por medio de un ácido para obtener la benzamida deseada (IV).

Esta benzamida posee interesantes propiedades farmacológicas como antiemético y modificador del comportamiento digestivo.  
 15

El esquema de reacción es el siguiente:



17.10.74



El ejemplo siguiente ilustra la presente invención, sin limitarla.

N-(diethylaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida

10 ETAPA I: N,N-dietilaminoetilhidroxilamina

En un matraz de un litro, provisto de un agitador, un termómetro y un refrigerante, se introducen 41,7 g (0,6 moles) de clorhidrato de hidroxilamina, 82,4 g (0,48 moles) de clorhidrato de N,N-dietilamino-2-cloroetano, 36 g de carbonato de sodio, 600 ml de etanol del 70% y 50 ml de agua.

Se calienta durante 8 horas a reflujo y se deja reposar durante una noche.

20 El alcohol se evapora bajo vacío, y el producto se somete a extracción tres veces con 200 ml de éter, después de diluir el residuo con carbonato de potasio.

La fase orgánica se seca sobre carbonato de potasio, se filtra, se evapora el éter y se destila el producto bajo vacío.

25 Se obtienen 29 g (Rendim.: 45%) de N,N-dietilami

noetilhidroxilamina (P. de Eb./10 mm: 102-106°C).

ETAPA II: 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehido-(N,N-dietilaminoetil)nitrona

5 En un matraz de 250 ml, provisto de agitador, termómetro y refrigerante, se colocan 6,40 g (0,03 moles) de 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehido, 3,96 g (0,03 moles) de N,N-dietilaminoetilhidroxilamina, y 90 ml de dioxano.

10 Se calienta durante cinco horas a reflujo, se deja reposar dos días, y se evapora el disolvente bajo vacío.

15 El residuo se pone en suspensión en 20 ml de agua y se alcaliniza con sosa. Se deja cristalizar, se filtra, se lava con agua, el producto cristalizado, y se seca en estufa a 50°C.

Se obtienen 5 g (Rendm.: 50%) de 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehido-(N,N-dietilaminoetil)nitrona (P. de f. 110°C).

20 ETAPA III: N-(dietilaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida

25 En un vaso de 500 ml se colocan 5 g (0,015 moles) de 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehido-(N,N-dietilaminoetil)nitrona, 15 ml de ácido acético y 15 ml de anhídrido acético, y se calienta durante diez minutos a 80-90°C. Se enfría, se añaden 50 ml de agua y sosa al 20% hasta un pH =

10. Se deja cristalizar, se filtra, se lava con agua y se seca en estufa a 50°C. El producto obtenido se disuelve en 150 ml de etanol y se añade etanol clorhídrico hasta un pH = 1. Se deja cristalizar, se filtra y se lava con un poco de etanol, y el producto se seca en estufa a 50°C.

Se obtienen 2,5 g (Rendim.: 46%) de clorhidrato de N-(dietilaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida (P. de f. 199-200°C).

Esta solicitud, que corresponde a la presentada en Francia, con fecha 10 de Septiembre de 1973, bajo el Nº 73/32560, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

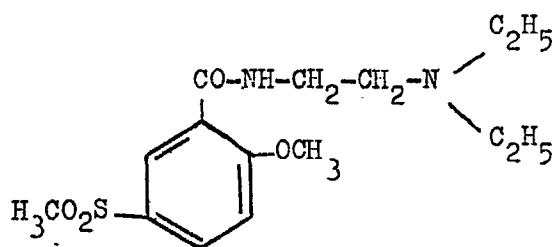
#### REIVINDICACIONES

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención, en España, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

1ª.- Procedimiento de preparación de N-(dietilami

noetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida representada por la fórmula

5



10

de sus sales de adición con ácidos minerales u orgánicos farmacéuticamente aceptables y de sus sales de amonio cuaternarias, caracterizado porque se trata 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehído con N,N-dietilaminoetil hidroxilamina, de modo que se obtiene 2-metoxi-5-metilsulfonilbenzaldehído-(N,N-dietilaminoetil)nitrona y porque se hidroliza por medio de un ácido para obtener N-(dietilaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida.

15

2ª.- Procedimiento de preparación de N-(dietilaminoetil)-2-metoxi-5-metilsulfonilbenzamida.

20

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

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

Madrid,

**22 OCT. 1974**

P.A.

**Alberto de Elizaburu**  
Por Poder.



17.10.74  
IAG/