

432225

10 DIC. 1975

P.- 59.018

112 Div

Int. Cl.:	C07D

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar PATENTE DE INVENCION por VEINTE años

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

Sociedad Anónima francesa

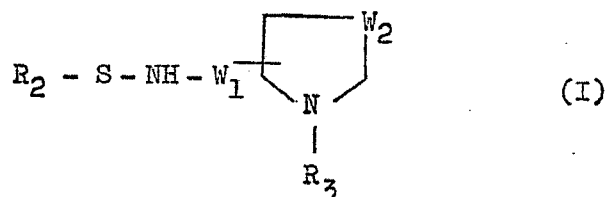
establecida en 46, Boulevard de Latour-Maubourg, 75-Paris
7^o, Francia

por: "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE NUEVOS COMPUESTOS DE
SULFENAMIDA"

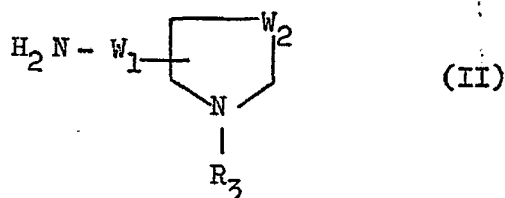
24-11-75

- 1 -

La presente invención tiene por objeto un procedimiento de preparación de nuevos compuestos de sulfenamida que responden a la fórmula general:



10 en la que R_2 es un resto orgánico, R_3 es un grupo alcoholo, W_1 y W_2 son grupos alcoholeno de bajo peso molecular, procedimiento que consiste en hacer reaccionar un compuesto aminado de fórmula general (II):



20 en el que R_3 , W_1 y W_2 tienen los significados antedichos, con un disulfuro orgánico.

Estos compuestos son útiles como sustancias intermedias en la síntesis de benzamidas farmacológicamen-

te activas, en particular como psicotropos, como por ejemplo la N(1-etil-2-pirrolidilmetil)-2-metoxi-5-sulfamoyl-benzamida, conocida con el nombre de SULPIRIDE.

En los derivados de sulfenamida de fórmula
5 (I), el resto orgánico R₂ comprende todos los grupos orgánicos que son susceptibles de transformarse en tiocompuestos; son grupos alifáticos, alicíclicos, aromáticos o heterocíclicos, tales como etilo, ciclohexilo, fenilo, orto-nitrofenilo, 2-piridilo, 4-piridilo, 5-nitro-2-piridilo,
10 pirimidilo, benzamidazolilo, benzotiazolilo, etc.

Como disulfuros orgánicos empleados en la presente invención, se incluyen, por ejemplo, los sulfuros de dialcoholo tales como el sulfuro de dimetilo, sulfuro de dietilo, sulfuro de metilo-etilo, sulfuro de dipropilo, etc.; disulfuros de alcoholo-arilo, tales como disulfuro de metilo-fenilo, disulfuro de etilo-fenilo, etc.;
15 disulfuros de diarilo tales como disulfuro de difenilo, disulfuro de ditoluido, etc.; disulfuros diheterocíclicos, tales como disulfuro de di(2-piridilo), disulfuro de
20 di(4-nitro-2-piridilo), disulfuro de di(2-benzotiazolilo), disulfuro de di(2-bencimidazolilo), etc.

El ejemplo siguiente ilustra la invención reivindicada, sin limitarla.

25 Ejemplo I

N-(1-etil-2-pirrolidilmetil)-o-nitrofenil-sulfenamida

5 46 g (0,15 moles) de disulfuro de o-o-nitro-
fenilo, 220 ml de tetracloruro de carbono y 0,3 g de yodo se introducen en un matraz de fondo redondo de 500 ml.

10 La mezcla se calienta a entre 55 y 65°C, y, después de introducir 11 g de cloro gaseoso, la disolución se filtra en caliente y después se concentra bajo vacío, eliminando unos 50 ml de disolvente.

15 Se introduce después, gota a gota, una disolución de 19,2 g de 1-etil-2-aminometil-pirrolidina (0,15 moles) en 200 ml de tetracloruro de carbono, manteniendo la temperatura a unos 25°C, se deja agitar dos horas y media a esta temperatura y se decanta el disolvente. Se añaden 150 ml de agua y 15 ml de amoníaco al 30%, y se somete a extracción 3 veces con 100 ml de cloroformo.

20 La disolución en cloroformo obtenida se lava con agua, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra, y se evapora el disolvente bajo vacío.

Se obtiene un aceite cuyo espectro de RMN es consecuente con la estructura esperada. (Rendimientos = 71,4%).

25 La presente solicitud que corresponde a la presentada en Francia, el 27 de Noviembre de 1.973, bajo el

número 73/42 266, se acoge a los beneficios del Artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

5

- REIVINDICACIONES -

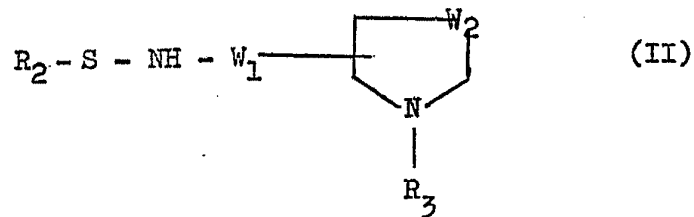
10

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:

15

1ª.- Procedimiento de preparación de nuevos compuestos de sulfenamida que responden a la fórmula general

20

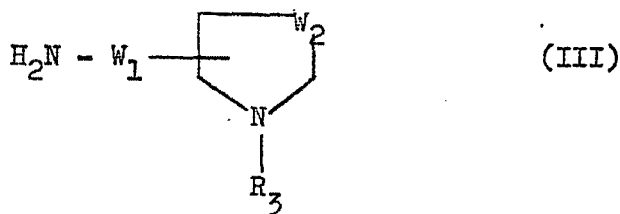


25

en la que R_2 es un resto orgánico, R_3 es un grupo alcoholilo,

W_1 y W_2 son grupos alcohileno de bajo peso molecular, procedimiento que consiste en hacer reaccionar un compuesto aminado de fórmula general (III)

5



10

donde R_3 , W_1 y W_2 tienen los significados antedichos, con un disulfuro orgánico.

2ª.- Procedimiento de preparación de nuevos compuestos de sulfenamida.

15

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

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

20

Madrid,

P.A.

18 DIC. 1975

Alberio de Elizarru
Por Poder

25

24-11-75
IGF.