

REF: H-121-Sp.



28 JUL

No 437.846

Int. Cl. C07C/1961B

## MEMORIA DESCRIPTIVA

correspondiente a la solicitud de concesión de una

### PATENTE DE INVENCION

SOLICITANTE: HOKURIKU PHARMACEUTICAL CO., LTD.

RESIDENCIA: 1-Chome, 3-14, Tatekawacho, Katsuyamashi

FUKUI, Japón.-

ENUNCIADO: UN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE

NUEVOS DERIVADOS DE DIFENILALILAMINOAL

CANOL.

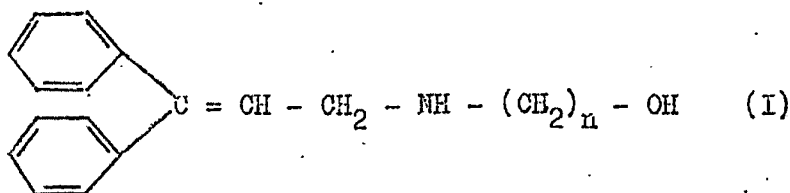
Prioridad: Patente japonesa n. Sho 49-57326 del 23.5.74.



1

Esta invención se refiere a nuevos difenilalilaminoalcanoles de fórmula.

5

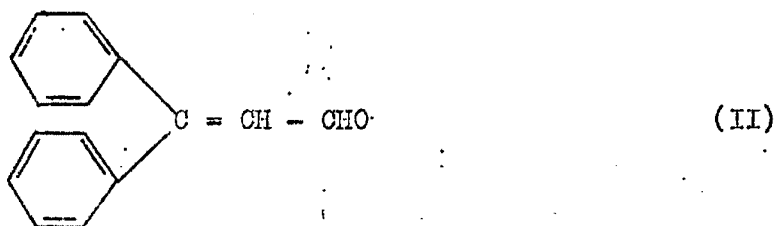


10

en la que n representa un número entero de 2 o 3, y las correspondientes sales de adición ácida de éstos.

El objeto de la invención es también un procedimiento para la obtención de los compuestos de fórmula (I), caracterizado por la condensación de  $\beta$ -fenilcinnamaldehído de fórmula:

15



20

con un aminoalcanol de fórmula general:



25

en la que n tiene el mismo significado que se indicó anteriormente, y reducción del producto de condensación así obtenido utilizando un agente de reducción tal como, por ejemplo, borohidruro sódico. Estos compuestos se obtienen principalmente por condensación de  $\beta$ -fenilcinnamaldehído (II) con un aminoalcanol (III) en cantidad equimolecular o en un exceso de hasta una relación molar 1:1,5 si es necesario en un disolvente tal como por ejemplo alcohol y a continuación se evapora a presión reducida hasta sequedad y reduciendo luego el producto de condensación obtenido con boro-

30



1 hidruro alcalino a la temperatura ambiente, preferiblemen-  
te a temperatura entre 10 y 20°C en un disolvente tal como  
alcohol, tetrahidrofurano, dimetilformamida, dioxano, dime-  
tilsulfóxido.

5 Los nuevos compuestos obtenidos mediante esta inven-  
ción se pueden transformar en las correspondientes sales  
con un ácido inorgánico u orgánico. Ejemplos específicos  
de tales ácidos inorgánicos son ácido clorhídrico, ácido  
bromhídrico, ácido sulfúrico, etc. Como ácidos orgánicos  
10 se pueden mencionar ácido maleico, ácido oxálico, ácido  
tartárico, ácido cítrico, ácido succínico, etc.

Los compuestos de esta invención son utilizables co-  
mo medicamentos con actividad anestésica local, antilépti-  
co, vasodilatadora coronaria y antiespasmódica y al mismo  
15 tiempo como productos intermedios para la obtención de o-  
tros medicamentos útiles que son el objeto de la solicitud  
de Patente Alemana P 2350125.9 de los mismos solicitantes.

La invención se ilustra mediante los ejemplos siguien-  
tes:

20 Ejemplo 1

2-(3,3-Difenilalilamino)-1-etanol

A una disolución de 4,16 g de  $\beta$ -fenilcinnamaldehído  
en 20 ml de etanol se añaden 1,22 g de 2-aminoetanol y la  
mezcla se evapora a presión reducida hasta sequedad. El re-  
25 siduo se disuelve en 10 ml de metanol y a la disolución de  
metanol se añaden 2,88 g de  $\text{NaEH}_4$  en pequeñas porciones  
con enfriamiento y la mezcla de reacción se agita durante  
4 horas a la temperatura ambiente. A continuación se evapo-  
ra el disolvente a presión reducida. Al residuo se añade  
30  $\text{CO}_3\text{K}_2$  al 10% y se extrae con  $\text{Cl}_3\text{CH}$ . El extracto se seca so-

21 MAY 1972

1 bre  $\text{SO}_4\text{Na}_2$  y a continuación se evapora para obtener 3,98 g  
de 2-(3,3-difenilalilamino)-1-etanol (73% de la cantidad  
teórica) en forma de un aceite viscoso. El aceite se trans-  
5 forma en oxalato de la manera convencional. El cristal ob-  
tenido se recristaliza a partir de isopropanol-etanol  
(1:1), p.f. 150-151°C.

Análisis elemental: como  $\text{C}_{17}\text{H}_{19}\text{NO} \cdot \text{C}_2\text{O}_4\text{H}_2$

Calculado: C, 66,46; H, 6,16; N, 4,08 %

Encontrado: C, 66,40; H, 6,19; N, 4,10 %

10 Ejemplo 2

3-(3,3-difenilalilamino)-1-propanol

A una disolución de 4,16 g de  $\beta$ -fenilcinnamaldehído  
en 20 ml de etanol se añaden 1,50 g de 3-amino-1-propanol  
y la mezcla se evapora a sequedad a presión reducida. Se  
15 disuelve el residuo en 10 ml de metanol y a la disolución  
se añaden 2,88 g de  $\text{NaBH}_4$  en pequeñas porciones con enfria-  
miento y la mezcla de reacción se agita durante 4 horas a  
la temperatura ambiente. A continuación se evapora el di-  
solvente a presión reducida. Al residuo se añade  $\text{CO}_3\text{K}_2$  al  
20 10% y se extrae con  $\text{Cl}_3\text{CH}$ . El extracto se seca sobre  $\text{SO}_4\text{Na}_2$   
y a continuación se evapora. El residuo se recristaliza a  
partir de benceno-n-hexano (1:1) para obtener 3,76 g de  
3-(3,3-difenilalilamino)-1-propanol (74% de la cantidad  
teórica), p.f. 93-95°C.

25 El cristal anterior se transforma en la sal de  $\text{ClH}$   
de la manera convencional, la sal de  $\text{ClH}$  se recristaliza  
a partir de isopropanol-etanol (1:1), p.f. 142-144°C.

Análisis elemental: como  $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{NO} \cdot \text{ClH}$

Calculado: C, 71,15; H, 7,30; N, 4,61 %

30 Encontrado: C: 71,02; H, 7,32; N, 4,64 %



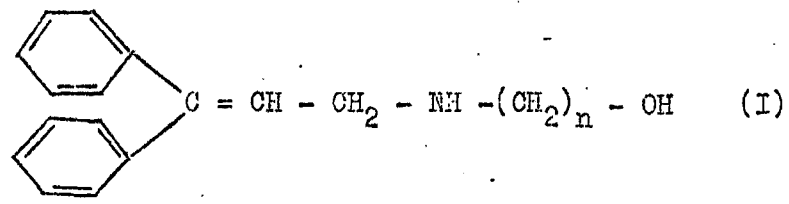
1

En resumen, la Patente de Invención que se solicita deberá recaer sobre las siguientes

REIVINDICACIONES

5

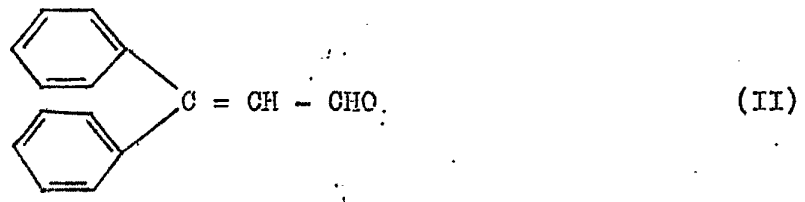
1. Un procedimiento para la obtención de nuevos derivados de difenilalilaminoalcohol de fórmula general



10

en la que n representa un número entero de 2 o 3, y las sales de éstos, que consiste en la condensación reductiva de  $\beta$ -fenilcinnamaldehído de fórmula

15



con un aminoalcohol de fórmula

20



en la que n tiene el significado anteriormente indicado.

2. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: UN PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS DERIVADOS DE DIFENILALILAMINOALCANOL.

25

30



1

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de seis páginas mecanografiadas.

5

Madrid, 21 Mayo 1.975  
BERNARDO UNGRIA  
P.P.

10

15

20

25

30