

MINISTERIO DE INDUSTRIA  
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ES	11 21	NUMERO 448.644	A1
	22	FECHA DE PRESENTACION 8-6-1976	

PATENTE DE INVENCION

P.- 63.165  
124

30 31	PRIORIDADES: NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
	75/18344	12-6-75	Francia

47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D//A61K	52 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
---------------------------	---	---

54 TITULO DE LA INVENCION
"UN PROCEDIMIENTO PARA PREPARAR NUEVAS ENAMINAS"

71 SOLICITANTE (S)
SOCIETE D'ETUDES SCIENTIFIQUES ET INDUSTRIELLES DE L'ILE-DE-FRANCE

DOMICILIO DEL SOLICITANTE
46, boulevard de Latour-Maubourg, 75-Paris 7 <sup>e</sup> , Francia

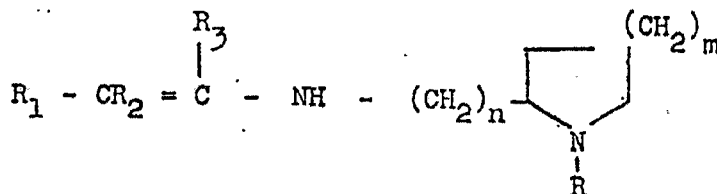
72 INVENTOR (ES)
Gérard Bulteau, Jacques Acher y Jean-Claude Monier

73 TITULAR (ES)

74 REPRESENTANTE
DON ALBERTO DE ELZABURU MARQUEZ

63.165  
724

1 La presente invención tiene por objeto nuevas e-  
naminas de la fórmula general siguiente:



10 en la que

R puede ser un grupo alcoholo de C<sub>1-5</sub> o alque-  
nilo de C<sub>2-5</sub> que contienen o no una función reactiva tal  
como alcohol, tialcohol, cetona, tiocetona, éter o tioé-  
ter;

15 R<sub>1</sub> puede ser un grupo alcoholo de 1 a 5 átomos  
de carbono o un grupo carboxilato de alcoholo, o un grupo  
acilo;

R<sub>2</sub> puede ser hidrógeno o un grupo alcoholo de  
1 a 5 átomos de carbono;

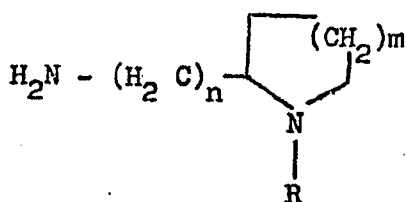
20 R<sub>3</sub> puede ser un grupo alcoholo de 1 a 5 átomos  
de carbono, o un grupo carboxilato de alcoholo;

R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> pueden estar unidos por intermedio de  
un grupo metileno, y

25 n y m pueden tomar los valores 1, 2 ó 3,  
así como sus isómeros dextrógiro y levógiro,  
sus sales de adición de ácido, sus sales de amonio cuater-  
nario y su procedimiento de preparación.

30 Los compuestos de la invención son utilizables,  
por ejemplo, en la síntesis de sustancias que poseen pro-  
piedades terapéuticas interesantes.

1 Los compuestos de la invención pueden ser prepara-  
 2 rados haciendo reaccionar cetonas que poseen un hidrógeno  
 3 móvil en posición  $\alpha$ ,  $\beta$ -dicetonas alifáticas o ésteres  
 4  $\beta$ -cetónicos, con una amina de la fórmula general siguien-  
 5 te:



10 en la que n, m y R tienen los valores indicados anterior-  
 mente.

El ejemplo que se proporciona a continuación pa-  
 ra ilustrar la invención no es limitativo.

15 Clorhidrato de N-(1-etil-2-pirrolidilmetil)-3-  
 aminocrotonato de metilo.

20 En un matraz de fondo redondo de 250 ml provisto  
 de agitador, termómetro, refrigerante y ampolla de bromo,  
 se introducen: 38,4 g (0,3 moles) de N-etil-2-aminometil-  
 25 pirrolidina y una gota de ácido clorhídrico de densidad  
 1,18 y se vierten gota a gota 34,8 g (0,3 moles) de ace-  
 toacetato de metilo. La temperatura alcanza 54°C al tér-  
 mino de la introducción. Seguidamente se deja que la mezcla  
 vuelva a la temperatura ambiente agitando continuamente  
 30 y después se añaden 150 ml de cloruro de metileno y 5 g  
 de sulfato de magnesio. Después de una hora de agitación  
 se filtra, se evapora el disolvente en vacío y se destila  
 el residuo. Se obtienen 55 g de N-(1-etil-2-pirrolidilmetil)-  
 -3-aminocrotonato de metilo. (rendimiento = 81,1%). Punto  
 de ebullición = 132-134°C a 3 mm de Hg.

1 En un vaso de precipitados de 500 ml se introducen 55 g (0,24 moles) de N-(1-etil-2-pirrolidilmetil)-3-aminocrotonato de metilo, 250 ml de acetona y etanol clorhídrico en cantidad suficiente para obtener un pH = 1, 5 agitando continuamente la mezcla. Se deja cristalizar el producto y a continuación se filtra y se seca en estufa a 50°C.

Se obtienen 60,8 g de clorhidrato de N-(1-etil-2-pirrolidilmetil)-3-aminocrotonato de metilo. (Rendimiento = 95,2%) Punto de fusión = 140°C.

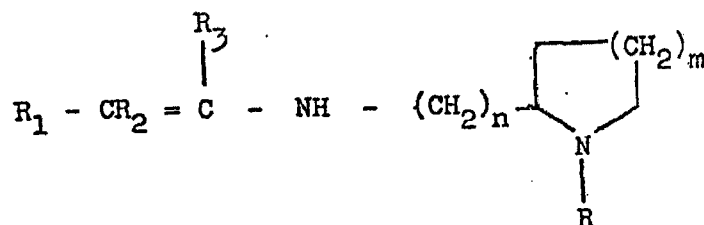
15

## REIVINDICACIONES

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:

1ª.- Un procedimiento para preparar nuevas enamidas de la fórmula general siguiente:

25



30



1 minas.

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

5 Esta Memoria consta de seis hojas escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, 06. JUL. 1976

P.A.

10

Alberto de Lizasoain

Por Poder



15

20

25

GM.

30