

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



ESPAÑA

Concedido el Registro de acuerdo con los datos que figuran en la presente descripción y según el contenido de la Memoria adjunta.

CERTIFICADO DE ADICION

476820

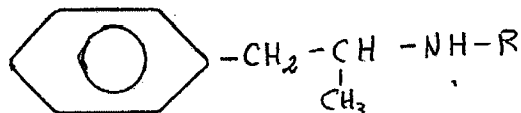
(19) ES	(11) NUMERO	(10) A2
(21)	476820	
(22)	FECHA DE PRESENTACION	
	12 - Enero - 1.979	

(30) PRIORIDADES: (31) NUMERO	(32) FECHA	(33) PAIS
Int. Cl: C07C 87/28		
(47) FECHA DE PUBLICIDAD	(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL C07C	(51) PATENTE A LA CUAL SE ADICIONA
(54) TITULO DE LA INVENCIÓN PERFECCIONAMIENTOS INTRODUCIDOS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL NUMERO 419.917, por: "PROCEDIMIENTO PARA SINTETIZAR UN D-DERIVADO DEL 1-FENIL-2-AMINOPROPANO"		
(71) SOLICITANTE (S) Industrial Farmacéutica de Levante, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE BARCELONA.- Mallorca, 216		
(72) INVENTOR (ES) D. Emilio Carrasco Yufera		
(73) TITULAR (ES) el solicitante		
(74) REPRESENTANTE DON VICENTE OCHOA SOUTO		

POOR
QUALITY

MEMORIA DESCRIPTIVA

La Patente principal, que constituye la base - del presente Certificado de Adición, se refiere a un -- procedimiento para sintetizar un n-derivado del 1-fenil 2-aminopropano



5 cuyo sustituyente en el nitrógeno amínico R sea un radi- cal $-CH_2-CH_2-$.

El método correspondiente a tal procedimiento consiste en que a partir de un mol de sulfato (\pm) 1-fe- nil-2-aminopropano que se disuelve en una cantidad sufi- ciente de agua destilada y se trata con hidróxido sódi- co acuoso al objeto de liberar la base. Esta base se -- extrae con éter sulfúrico, agitando fuertemente.

Se separa la amina así obtenida con éter por - destilación a presión reducida.

15 La amina obtenida se trata con un ligero exce- so de cloruro de fenacetilsulfonilo a la temperatura de 0°C disuelto en cloruro de metileno conteniendo piridi- na.

20 Se separa finalmente la sulfamida así obtenida precipitándolas sobre el ácido sulfúrico diluido a 0°, se filtra y se seca.

Paralelamente, se trata a 0° un mol de acril- nitrilo con ácido clorhídrico gaseoso y seco hasta que el incremento de peso del nitrilo sea aproximadamente - de 1 mol de ácido clorhídrico.

El líquido obtenido, de color ligeramente ama-

rillante, se destila, se lava con solución de carbonato sódico al 10% y se seca con sulfato sódico anhidro. Se redestila y seguidamente la alquilación se efectúa
30 mezclando doble cantidad en moles de cloropropionitrilo que de la sulfamida, con K_2CO_3 seco en acetona a temperatura ambiente.

La extracción del grupo fenacilo se realiza --
añadiendo el doble de exceso en moles de Zn en polvo --
35 a una solución de fenacetilsulfamida en acético con -- cantidades catalíticas de ácido clorhídrico concentrado.

Finalmente se filtra y lava el residuo de Zn separando el filtrado y éste se diluye en éter etílico
40 y se hace pasar una corriente de ácido clorhídrico gaseoso y seco con lo que precipita el clorhidrato de la amina secundaria.

Por último se filtra, seca y recristaliza en un disolvente muy poco polar, obteniéndose un polvo --
45 blanco y cristalino.

El objeto del presente Certificado de Adición, conservando todas las características del procedimiento a que se refiere la Patente principal, consiste en que la extracción de la solución acuosa del (+) 1-fenil-2-aminopropano en forma de base libre se realiza --
50 con disolventes orgánicos no miscibles con agua, tales como cloroformo, tricloroetileno, etc., en sustitución del éter etílico o sulfúrico utilizados en la Patente principal.

Paralelamente, la precipitación del clorhidrato de la amina secundaria, se realiza con un disolvente orgánico que sustituye al éter etílico o sulfúrico, siendo dicho disolvente orgánico cloroformo, tricloroetileno, acetona o alcohol etílico.

60 Los resultados obtenidos con estos productos, en uno y otro caso, son similares a los obtenidos con los productos previstos en la Patente principal, ofreciendo no obstante una peligrosidad considerablemente menor en su manejo.

= N O T A =
=====

65 Descrito suficientemente el objeto de este - Certificado de Adición, se declaran de novedad las -- siguientes

.....ooOoo=====

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

70 1ª.- Perfeccionamientos introducidos en el ob-
jeto de la Patente principal número 419.917, por: "PRO-
CEDIMIENTO PARA SINTETIZAR UN N-DERIVADO DEL 1-FENIL-2-
AMINOPROPANO", esencialmente caracterizados porque la -
75 extracción de la solución acuosa del (+) 1-fenil-2-ami-
nopropano en forma de base libre, se realiza con disol-
ventes orgánicos no miscibles en agua, tales como cloro
formo, tricloroetileno, o similares.

80 2ª.- Perfeccionamientos introducidos en el ob-
jeto de la Patente principal número 419.917, por: "PRO-
CEDIMIENTO PARA SINTETIZAR UN N-DERIVADO DEL 1-FENIL-2-
AMINOPROPANO", según reivindicación primera, caracteri-
zado porque la precipitación del clorhidrato de la ami-
na secundaria se realiza asimismo con un disolvente --
orgánico tal como cloroformo, tricloroetileno, acetona
o alcohol etílico.

85 3ª.- PERFECCIONAMIENTOS INTRODUCIDOS EN EL OB-
JETO DE LA PATENTE PRINCIPAL NUMERO 419.917, por: "PRO-
CEDIMIENTO PARA SINTETIZAR UN N-DERIVADO DEL 1-FENIL-2-
AMINOPROPANO".

90 Todo ello según se describe y reivindica en la
presente Memoria Descriptiva, que consta de cuatro ho-
jas mecanografiadas por una sola de sus caras y debida-
mente numeradas.

Madrid, 12 de Enero de 1.979

VICENTE OCHOA
E.E.

