



30 JUN



153564

5

en los medicamentos de efedra, poseen valiosas propiedades terapéuticas, pudiendo por ejemplo encontrar excelente empleo en las dolencias asmáticas y en las enfermedades de los bronquios ante todo, en los casos en los cuales, además de conseguir este efecto específico, no se desea influir de modo alguno sobre el sistema circulatorio.

10

15

Se trató ya de fabricar 1-fenil-2-dimetilamino-propanoles (1) mediante yoduro de metilo por metilación de los 1-fenil-2-metilamino-propanoles (1) y especialmente de la 1-efedrina natural. Sin embargo se obtiene en este caso, además de la metilefedrina esperada, material inicial parcialmente inalterado así como sal cuaternaria. También se propuso ya transformar el 1-fenil-2-metilamino-propanol (1) en 1-fenil-2-dimetilamino-propanol (1) sometiéndolo a hidrogenación catalítica en presencia de formaldehído empleando un catalizador de platino coloidal. Este procedimiento conduce a rendimientos satisfactorios cuando se emplean pequeñas cantidades, pero no puede emplearse sin más para la preparación en escala industrial ya que entonces la hidrogenación se realiza sólo de manera incompleta produciendo mezclas de material inicial y de producto de metilación.

20

25

30

Ahora bien, se comprobó que la preparación de los 1-fenil-2-dimetilamino-propanoles (1) estereoisómeros puede realizarse de manera extraordinariamente sencilla y con rendimiento prácticamente cuantitativo cuando, en contraposición al procedimiento conocido, se hace

30 JUN 1940



1 535 64

actuar sobre las sales del 1-fenil-2-amino y respectivamente 2-metilamino-propanoles (1) formaldehido en ausencia de catalizador y convenientemente bajo presión.

Este sencillo procedimiento en el cual se emplean convenientemente por cada parte del alcohol amínico 2-3 partes aproximadamente de solución de formaldehido al 40 %, es fácil también en escala industrial y realizable con rendimientos cuantitativos.

Ejemplos

1). Se calientan en autoclave, durante 3 horas, a 120° aproximadamente 72 partes de hidrocioruro de la efedrina levogira con 150 partes de una solución de formaldehido al 40%. Después del enfriamiento se precipita con lejía de sosa, de la solución de reacción clara como el agua, la base levogira de metilefedrina con rendimiento cuantitativo. Después del secado y de la recristalización de éter de petróleo, funde a temperaturas de 87-88°.

2). Se calientan a 125° aproximadamente, durante 3 horas, 78 partes de hidrocioruro de 1-fenil-2-amino-propanol con 300 partes de una solución de formaldehido al 40 %. De la solución de reacción enfriada se obtiene con lejía de sosa, con rendimiento casi cuantitativo, el 1-fenil-2-dimetilamino-propanol racémico que, después del secado y de la recristalización de éter de petróleo, funde a 63-64°.

Esta solicitud, que corresponde a la presentada en Alemania, el 20 de Febrero de 1940, bajo el número T. 53.433 IVc/12q, se acoge a los beneficios del

30



artículo 51 del Estatuto vigente sobre Propiedad Industrial.

153564

===== N O T A =====

5

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

10

1º. Un procedimiento para la obtención de los 1-fenil-2-dimetilamino-propanoles (1) estereoisómeros, caracterizado por hacerse actuar sobre sales, y especialmente sobre sales de ácidos inorgánicos, de 1-fenil-2-amino- y respectivamente -2-metilamino-propanoles (1), aldehído fórmico en ausencia de catalizador y convenientemente bajo presión.

15

2º. Un procedimiento para la obtención de los ésteres-isómeros 1-fenil-2-dimetilaminopropanoles (1).

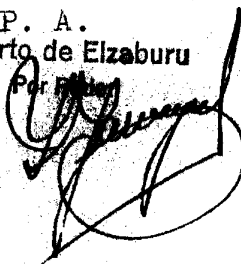
Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y para los fines que se han especificado.

20

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

Madrid a 30 JUN. 1941

P. A.  
Alberto de Elzaburu

Por 

153564