

190607



A/T.-

190007

MEMORIA DESCRIPTIVA

para una patente de Invención, por veinte años, por: "Procedimiento para la preparación de los esteres del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropionico (Fenilserina) y sus derivados N-acilicos y N,O-acilicos a partir del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropionico", a favor de la r.s. Lepetit S.A., residente en Milán (Italia) 32 Via Carlo Tenca.-

=====

Los esteres del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropionico y sus derivados N-acilicos y N,O-acilicos no se han descrito hasta hoy en la literatura.

5 Su preparación reviste un interés particular ya que estas sustancias contienen un grupo amino-alifático y un oxhidrilo alcohólico, perteneciendo así a la clase de los aminoalcoholes.

Dada esta su naturaleza dichas sustancias son intermedios útiles para la fabricación de numerosos productos orgánicos



de importancia práctica, como sustancias tensioactivas imbibidoras para la industria textil y para productos farmacéuticos.

Hemos descubierto que la preparación de estos esteres del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropiónico y sus N-acil y N,O-acilderivados puede realizarse fácilmente mediante acción del ácido clorhídrico gaseoso sobre la disolución del ácido alfa-amino-beta-hidroxi -fenil-propiónico en el alcohol deseado. En primera fase se obtiene el clorhidrato del éster, del cual se puede obtener fácilmente el mismo éster.

Los acilderivados de los esteres preparados de este modo se obtienen por acilación directa de los mismos esteres.

El ácido alfa-amino-beta-hidroxi -fenilpropiónico puede prepararse por los métodos ya descritos en la literatura.

Ejemplo 1º.- 200 g. de fenilserina se disuelven a ebullición en 1000 cm³ de alcohol absoluto. Después se hace borbotar a temperatura ordinaria o superior a la ordinaria, ácido clorhídrico gaseoso anhidro durante unas dos horas.

Después la disolución alcohólica se concentra a pequeño volumen, se recoge en agua y se satura de carbonato potásico anhidro agregando hielo.

A continuación se extrae el éster con un disolvente adecuado, por ejemplo éter etílico, y la disolución etérea luego se seca y se destila el éter hasta pequeño volumen; por adición de éter de petróleo y enfriamiento en hielo se obtienen 160 gramos de éster etílico de la fenilserina, con un rendimiento por consiguiente que corresponde al 70 % del teórico.

El éster etílico de la fenilserina se presenta como una



sustancia cristalina blanca con punto de fusión de 85°.

Por titulación acidimétrica en presencia de naranja de metilo produce sin más un título prácticamente del 100 %.

Ejemplo 2°.- 200 g. de fenilserina se disuelven a ebullición en 1000 cm³ de alcohol butílico anhidro. Después a la temperatura ordinaria o superior a la ordinaria, se hace borbotar ácido clorhídrico gaseoso y anhidro durante unas dos horas. La disolución alcohólica se concentra luego a pequeño volumen, con lo que cristaliza el clorhidrato del éster butílico de la fenilserina como sustancia cristalina de punto de fusión 116-117°. Este clorhidrato se puede obtener con un rendimiento de cerca del 95 %. Del clorhidrato separado del líquido alcohólico concentrado o directamente del residuo de la destilación del alcohol butílico, puede obtenerse el éster butílico de la fenilserina por tratamiento con alcoholes y extracción con éter etílico.

De la disolución etérea secada, por destilación del éter, se obtiene el éster butílico de la fenilserina como sustancia cristalina blanca con punto de fusión de 51-52°. y con un rendimiento del 85% del clorhidrato y del 80 % directamente de la fenilserina.

Ejemplo 3°.- 20 g. del éster etílico de la fenilserina, obtenido como en el ejemplo 1°, se calientan durante una hora a ebullición con 100 g. de una mezcla a partes iguales de anhídrido acético y piridina. Se echa después esta mezcla en hielo y tras neutralizar, se separa el derivado N,O-diacetilico del éster de la fenilserina con punto de fusión de 169-

190607



1702.

N O T A.-
=====

La presente patente, conste las siguientes reivindicaciones:

- 5 1.- Procedimiento para la preparación de los esteres de la fenilserina caracterizado porque la fenilserina se esterifica en el alcohol adecuado mediante acción del ácido clorhídrico gaseoso al punto de ebullición del alcohol.
- 10 2.- Procedimiento según lo reivindicado en el punto 1), caracterizado porque primeramente se obtienen los clorhidratos de los correspondientes esteres, de los cuales por acción de los alcoholes se pueden obtener los esteres en estado libre.
- 15 3.- Procedimiento de preparación de los acilderivados de los esteres de la fenilserina, caracterizado porque los esteres de la fenilserina obtenidos según lo reivindicado en el punto 1), se someten a acilación directa por medio de convenientes acilantes.
- 20 4.- Procedimiento para la preparación de los esteres del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropiónico (Fenilserina). y sus derivados N-acílicos y N,O-acílicos a partir del ácido alfa-amino-beta-hidroxi-fenilpropiónico.

Según se describe y reivindica en esta memoria descriptiva.

25 La cual consta de 5 hojas foliadas y escritas a má-

190607

-5-

quina por una sola de sus caras.

Madrid, a 29 de Noviembre de 1949.

[Handwritten signature]

29 NOV. 1949

