



PATENTE DE INVENCION

SC. 903.-"ALLO-(NITRO-4'-PHENIL)-1-DICHLORACETIL-AMINO-2-CHLORO-3-PROPANOLS-1 OPTIQUEMENT ACTIFS"

1 9 6 7 7 6

1 9 6 7 7 6

M E M O R I A D E S C R I P T I V A

sobre:

"Procedimiento de preparación de allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente "activos".

=====

SOLICITANTES: SOCIÉTÉ DES USINES CHIMIQUES RHONE POULENC,
domiciliados en 21 Rue Jean Goujon, Paris, Francia.

=====

- En la solicitud de patente española nº 196.659 depositada el 22 de febrero de 1951, por "Nuevo procedimiento para la preparación del p.nitrofenilo-1-dicloracetilamino-2-propanadiol-1,3 , se ha descrito entre otras, la preparación
5. del allo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanol-1 racémico, a partir del allo-diclorometilo-2-nitro-4'-fenilo)-hidroximetilo-4-oxazolina-2 racémica por reacción del ácido clorhídrico seco en el dioxano anhidro a la temperatura del baño Maria.
 10. La presente invención se refiere a la preparación



196776

de los allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente activos a partir de los allo-diclorometilo-2-(nitro-4'-fenilo)-hidroximetilo-4-oxazolin-2 correspondientes, mediante reacción del ácido clorhídrico seco.

15.

Se ha descubierto además, que no era necesario que la reacción se efectúe a la temperatura del baño María, sino que podía ser igualmente conveniente efectuarla a la temperatura ordinaria.

20.

Los allo-(nitro-4'-fenilo)-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente activos obtenidos según la presente invención constituyen unos agentes intermedios para la preparación de productos antibióticos.

25.

Los ejemplos siguientes demuestran, a título no limitativo, el modo en que la invención puede ejecutarse en la práctica.

EJEMPLO 1.

30.

1,86 g. de allo-diclorometilo-2-(nitro-4'-fenilo)-hidroximetilo-4-oxazolina-2 de punto de fusión (capilar) = 142° C. y $[\alpha]_D^{25}$ (c = 4% en la acetona) = -37° se disuelven a temperatura ordinaria en 19 cm³ de dioxano a 13% de ácido clorhídrico. Se deja en reposo durante 3 horas, se extrae el disolvente y el exceso de ácido clorhídrico por evaporación a presión reducida a temperatura

35.

ordinaria. Se absorbe el residuo con 2 cm³ de metanol, se añaden 25 cm³ de agua: cristaliza un producto que se orea, se lava con agua y se seca en vacío sulfúrico. De este modo se obtiene 1,36 g. de allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanol-1 de punto de fusión (capilar)

40.

= 114-116° C. y $[\alpha]_D^{25}$ (c = 4% en el metanol) = -12°36.

1 MAR 1961



- 3 - 196776

EJEMPLO 2.

Trabajando en las mismas condiciones con 0,62 g. de allo-diclorometilo-2-(nitro-4'-fenilo)-hidroximetilo-4-oxazolina-2 $\left[\alpha \right]_D^{25}$ (c = 4% en acetona) = + 37°, se obtienen 45. 0,27 g. del antípoda óptico del compuesto obtenido en el ejemplo 1.

N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe 50. hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de patente presentada en Francia con fecha 29 de junio de 1950, nº 592994, 55. acogiéndose, por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, y siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención, por 20 años en España: "Procedimiento de preparación de allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-60. cloro-3-propanoles-1 ópticamente activos"; caracterizándose por lo siguiente:

1º.= Procedimiento de preparación de allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente 65. activos, caracterizándose porque se hacen reaccionar sobre las allo-diclorometilo-2-(nitro-4'-fenilo)-hidroximetilo-4-oxazolininas-2 correspondientes, el ácido clorhídrico seco a temperatura ordinaria en un disolvente anhidro, tal como el dioxano.

2º.= Procedimiento de preparación de allo-(nitro-4'-fenilo)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente 70.

1 MAR.



- 4 -

196776

activos; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria, que consta de cuatro hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 12 de marzo de 1951.

SOCIÉTÉ DES USINES CHIMIQUES RHONE POULENC.

P.P. de J. GOMEZ ACEBO y MODET