



PATENTE DE INVENCION

SC. 904. "THREOCHLORPROPANOLS OPTIQUEMENT ACTIFS"

196777 1 06777

MEMORIA DESCRIPTIVA

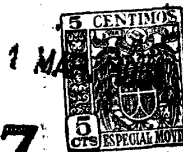
sobre:

"Procedimiento de preparación de los treo-p.nitrofenilo-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 196.660,
depositada en 22 de febrero de 1951, por "Procedimiento para
la obtención de treo y allo-p.nitrofenilo-1-dicloracetil-
amine-2-cloro-3-propanol-1" , se ha descrito entre otros, el
5. paso del allo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-
propanol-1 racémico a su derivado treo correspondiente por
reacción del ácido sulfúrico y después del amoniaco
diluido.

La presente invención tiene por objeto la aplica-
10. ción de dicha reacción de epimerización a los allo-(nitro-4'-



fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 óptica-mente activos.

Los treo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1 ópticamente activos así obtenidos son unos agentes importantes para la síntesis de antibióticos.

Los ejemplos siguientes representan en que forma puede realizarse en la práctica el objeto de la presente invención. Los puntos de fusión indicados han sido determinados al tubo capilar.

20. EJEMPLO 1.

0,70 gr. de allo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetil-amino-2-cloro-3-propanol-1 de punto de fusión = 114 - 116° C. y $[\alpha]_D^{25} = 12236$ (c= 4% en el metanol) se disuelven a unos 0° C. en 2,8 cm³ de ácido sulfúrico 66° Bé. Se calienta la solución obtenida durante 25 minutos a 45° C., después se la vierte en 20 grs. de hielo triturado. Se añaden 10 cm³ de metanol para facilitar la disolución del sulfato ácido de (nitro-4'-fenil)-1-dicloracetoxi-1-amino-2-cloro-3-propano que se precipita. Se hace alcalina la solución obtenida con el amoniaco a 22° Bé. El producto que cristaliza se orea, se lava con agua y se seca en el secador sobre ácido sulfúrico. De este modo se obtienen 0,55 gr. de treo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanol-1 bruto con punto de fusión = 126 - 127° C. $[\alpha]_D^{26} = + 18235$ (c= 4% en el acetato de etilo) que después de purificación presenta las características siguientes: punto de fusión = 130-131° C. $[\alpha]_D^{23} = + 20239$ (c = 4% en el acetato de etilo).

EJEMPLO 2.

40. 0,19 g. de allo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetil-

1 MAR



- 3 -

196777

- amino-2-cloro-3-propanol-1 bruto de punto de fusión = 79° C.
y $[\alpha]_D^{25} = +10.40$ (c = 4% en el metanol) se tratan como
en el ejemplo 1, respetando las proporciones. Se obtiene
0,12 g. de treo-(nitro-4'-fenil)-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-
45. propanol-1 bruto de punto de fusión = 125-128° C. y
 $[\alpha]_D^{26} = -18.50$ (c = 2% en el acetato de etilo) y que después
de purificación presenta las características siguientes:
punto de fusión = 150-151° C. $[\alpha]_D^{25} = -21.50$ (c = 4,6%
en el acetato de etilo).

50.

N O T A

- Descrita suficientemente la naturaleza del
invento, así como la manera de realizarlo en la práctica,
debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente
indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en
55. cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace
constar que el invento corresponde a una solicitud de
patente presentada en Francia con fecha 3 de julio de 1950,
nº 593.182 acogiéndose, por lo tanto, a los beneficios que
conceden los Convenios Internacionales en vigor y siendo lo
60. que constituye su esencia y por lo que se solicita Patente de
invención, por 20 años en España: "Procedimiento de preparación
de los treo-p,nitrofenilo-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-
propanoles-1 ópticamente activos"; caracterizándose por lo
siguiente:
65. 1º.= Procedimiento de preparación de los treo-
p,nitrofenilo-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1
ópticamente activos, caracterizándose porque se tratan los
derivados allo correspondientes con el ácido sulfúrico a
unos 45° y después con amoníaco.
70. 2º.= Procedimiento de preparación de los treo-

196777



p.nitrofenilo-1-dicloracetilamino-2-cloro-3-propanoles-1
ópticamente 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