

256437



256437

P A T E N T E  
D E  
I N T R O D U C C I O N

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE COMPUESTOS DERIVADOS DE LA 3-(5'-NITROFURFURILIDENAMINO)-2-OXAZOLIDONA", a favor de la razón social española SOCIEDAD GENERAL DE FARMACIA, S.A., domiciliada en MADRID, Sagasta, núm. 13.

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención, realizada con éxito en el extranjero, se refiere a un procedimiento para la preparación de compuestos derivados de la 3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona.

5. Más concretamente se refiere a un procedimiento para la preparación de derivados 5-susbtituídos de la 3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona, de fórmula



'3-256437



.3.

mediante carbonato de etilo y catalizando la reacción con un alcoholato alcalino.

La 3-substituída 2-hidroxi-propil-hidracina, se obtiene por apertura del anillo oxiránico del 3-substituído 1,2-epoxipropano con hidrato de hidracina.

5.

El 3-substituído 1,2-epoxipropano se obtiene por procedimientos conocidos descritos en la literatura.

Así pues, el compuesto resultante, de estructura 3-amino-2-oxazolidona substituída en posición 5, se hace reaccionar luego con el 5-nitrofurfural obtenido a partir de su diacetato por hidrólisis sulfúrica. La condensación se hace a temperatura ambiente y en medio acuoso, precipitando el producto final mediante neutralización de toda la masa reaccionante con carbonato sódico.

10.

15.

Para facilitar la comprensión de este procedimiento se describen a continuación varios ejemplos prácticos referentes a las distintas fases de obtención del producto que resulta de substituir el radical R, concretamente por el oxatetrametilen-aminometil (morfolinometil), en la fórmula general dada anteriormente.

20.

#### EJEMPLO 1.

##### Obtención de 1-morfolino-2,3-epoxipropano.

Una mezcla equimolecular de epiclorhidrina y morfolina se agitan durante 6 horas, regulando la temperatura de baño de hielo de manera que al principio sea de 5° y al final de 30°C. Se abandona a la temperatura ambiente durante 24 horas.

25.

Por espacio de 2 horas se añaden la cantidad equimolecular de hidróxido sódico al 40%, procurando que la temperatura no sobrepase los 25°C.

30.

Después de extraer con éter, secar con hidróxido potásico



256437

sico y eliminar el disolvente, se obtiene un líquido de punto de ebullición (6 mm) : 85-89°C.

Rendimiento: 66%.

E J E M P L O 2.

5. Obtención de 3-morfolino-2-hidroxi-propil-hidracina.

500 ml (8 mols) de hidrato de hidracina al 80% se enfrían a 0-3°C. y les son adicionados 114 g (0,8 mols) de 1-morfolino-2,3-epoxipropano. La adición se realiza de forma que dure una hora. Durante otra hora se mantiene la temperatura de 0-10°C y la agitación. Se abandona la mezcla a temperatura ambiente durante 24 horas.

Eliminando el hidrato de hidracina por destilación a presión reducida, se obtiene un líquido de punto de ebullición (6 mm) 173-176°. Rendimiento 75-80% del teórico.

15. E J E M P L O 3.

Obtención de 3-amino-5-morfolinometil-2-oxazolidona.

175 g (1 mol) de 3-morfolino-2-hidroxi-propil-hidracina son adicionados a 114 g (1'2 mols) de carbonato de etilo y una solución de metilato sódico en metanol recién preparada por adición de 2'8 g de sodio metal a 50 ml de metanol. Se calienta la mezcla de forma que destile una mezcla de punto de ebullición 66° punto de alcohol metílico y alcohol etílico. Destila prácticamente la cantidad estequiométrica de alcohol. Al residuo de la destilación se le adiciona 60 ml de etanol absoluto. Se abandona para que cristalice. El producto recristalizado dos veces del etanol absoluto tiene un punto de fusión 123-124°C. Rendimiento 65% del teórico.

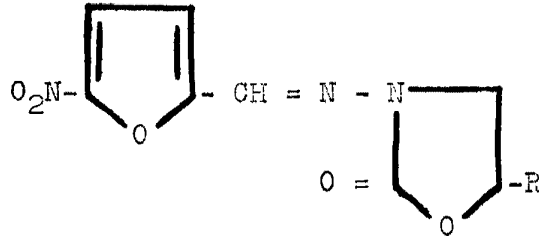
E J E M P L O 4.

30. Obtención de 5-morfolinometil-3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona.



256437

derivados de la 3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona de fórmula general



en la que R representa un radical aminoalquílico, mono- o di-alquiloamino-alquílico, mono- o di-hidroxiálquilo-amino-

- 5. -alquílico u oxipolimetilen-amino-alquílico, caracterizado por la condensación del 5-nitrofurfural-diacetato con la correspondiente 3-amino-2-oxazolidona 5-substituída por los radicales citados y obtenida por ciclación con carbonato de etilo en presencia de un alcoholato alcalino de la
- 10. 3-substituída 2-hidroxipropil hidracina, compuesto que resulta de la apertura con hidrato de hidracina del anillo oxiránico del 3-substituído, 1,2-epoxipropano.

- 2. Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado por la ciclación de la 3-substituída 2-hidroxipropil hidracina con carbonato de etilo y un alcoholato alcalino, para sintetizar la 5-substituída 3-amino-2-oxazolidona.

- 15. 3. Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado por la apertura con hidrato de hidracina del anillo oxiránico del 3-substituído 1,2-epoxipropano.

- 20. 4. Procedimiento, según la reivindicación 1, caracterizado porque la condensación de la 5-substituída 3-amino-2-oxazolidona con el 5-nitrofurfural o su diacetato, se realiza a temperatura ambiente y en medio acuoso, separándose el compuesto por neutralización con carbonato sódico.

7



256437

5. Procedimiento para la preparación de compuestos derivados de la 3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona, caracterizado por el hecho de efectuar la sustitución, en posición 5 con radicales aminoalquílicos, mono- o di-hidroxi-alquil-amino alquílico y oxapolimetilen-amino-alquílico.

6. Procedimiento para la preparación de compuestos derivados de la 3-(5'-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidona.

10. Según se describe y reivindica en la presente memoria, la cual consta de siete hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras, acompañadas de la documentación correspondiente.

Madrid, a 11 de Marzo de 1.960.

SOCIEDAD GENERAL DE FARMACIA, S.A.

p. a.

THE SOCIETY OF PATENT