



279905

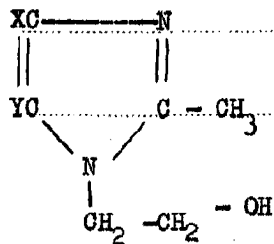
MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de un

Patente de Invención

por VEINTE años en España, por "PROCEDIMIENTO DE

PREPARACION DE COMPUESTOS DE FORMULA GENERAL:



a favor de

Soc. Acc. Mugolio di Picollo & Co.

domiciliado en Milán (Italia).- Via. B. Lanino, 5.

Prioridad.- De la solicitud de Patente Italiana nº 15.580, del 12 de Agosto de 1961.

Inventor.- Luigi Picollo, de nacionalidad italiana.

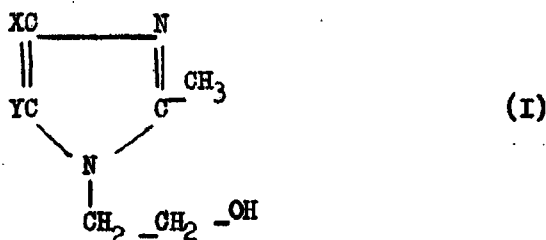
279905



Esta Patente se relaciona con la preparaci3n de nuevos deriva-
dos de la imidazola.

M1s particularmente, se relaciona con la preparaci3n de produ-
tos de la siguiente f3rmula general:

5

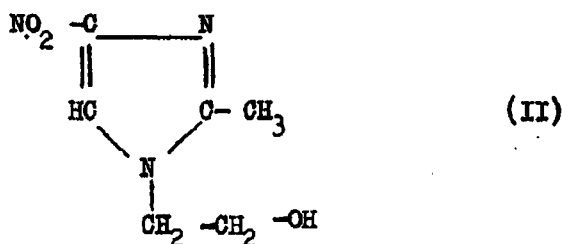


10

en la que, cuando X representa un 1tomo de H, Y representa NO₂ y vi-
ceversa.

Adem1s, la 1-(2-hidroxietyl)-2-metil-4-nitro-imidazola de f3r-
mula

15



es objeto de esta invenci3n, como nuevo compuesto.

20

De acuerdo con esta invenci3n, los compuestos anteriormente
citados pueden prepararse convenientemente reaccionando 3xido de etil-
eno con 2-metil-(4 3 5)-nitro-imidazola a una temperatura comprendida
entre 100 y 160°C, durante un per3odo de tiempo que oscila entre 30
minutos y 48 horas.

25

Pueden emplearse disolventes en el proceso con el fin de poner
a los reactivos en un contacto mejor. Tambi3n pueden usarse cataliza-
dores, a excepci3n de los b1sicos.

30

La 1-(2-hidroxietyl)-2-metil-4-nitro-imidazola es un valioso
producto intermedio en la preparaci3n de otras sustancias, pero mues-
tra tambi3n interesantes propiedades farmacol3gicas por s3 misma,
por lo que puede usarse terap3uticamente como tal.

279905



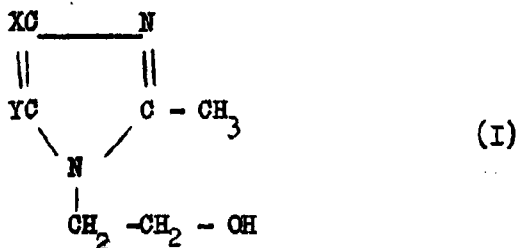
EJEMPLO

Se coloca en un recipiente a prueba de presiones una solución de 1 molécula-gramo de 2-metil-(4 ó 5)-nitro-imidazola en alcohol etílico. Se disuelve en etanol el mismo número de moléculas-gramo de óxido de etileno, se añade la resultante solución a la primera y se inicia el calentamiento, manteniéndose la temperatura entre 140 y 150°C durante unas 3 horas y dejándose enfriar luego la mezcla. Seguidamente se evapora el disolvente y el residuo, después de liberarse de los materiales resinosos, es reocrystalizado a partir de cloroformo. Tras su enfriamiento y parcial concentración, la 1-(2-hidroxietil)-2-metil-4-nitroimidazola, de un punto de fusión de 130°C (II), se separa. Una completa evaporación del cloroformo conduce a la formación de 1-(hidroxietil)-2-metil-5-nitro-imidazola cruda. Cuando se reocrystaliza ésta a partir de acetato de etilo o agua, da el producto puro, de un punto de fusión de 158 a 160°C.

REIVINDICACIONES

EN RESUMEN: La Patente de Invención que se solicita, recaerá sobre las reivindicaciones siguientes:

1°. Procedimiento de preparación de compuestos de fórmula general



en la que, cuando X representa un átomo de H, Y representa NO₂ y viceversa, cuyo procedimiento se caracteriza por el hecho de que se hace reaccionar óxido de etileno con 2-metil-(4 ó 5)-nitro-imidazola.

2°. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que mediante un subsiguiente enfriamiento y concentración parcial, se obtiene 1-(2-hidroxietil)-2-metil-4-nitro-imidazola.

279905, 2100

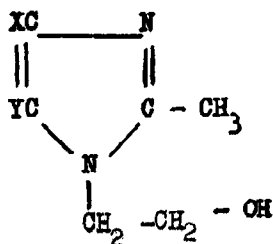


3°. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que la reacción se lleva a cabo a una temperatura del orden de 100 á 160°C, con una duración de 30 minutos a 48 horas.

5 4°. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que la reacción se lleva a cabo en presencia de catalizadores ácidos.

5°. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que la evaporación se lleva a cabo hasta su completamiento y se obtiene 1-(2-hidroxi-etil)-2-metil-5-nitro-imidazola.

10 6°. Se reivindica por último, como objeto sobre el que ha de recaer la presente Patente de Invención que se solicita, por: "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE COMPUESTOS DE FORMULA GENERAL:



15

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente Memoria Descriptiva que consta de cuatro páginas escritas a máquina por una sola cara.

20

Madrid, 8 de Agosto de 1962

ALFONSO UNGRIA

[Handwritten signature]