



341680

P A T E N T E   D E   I N V E N C I O N

por VEINTE años

cuyo privilegio se solicita para todos el territorio nacional, a favor de:

M<sup>a</sup> LUISA TORRAS FALGUERA

Domiciliada en Barcelona, calle de Gerona nº 90, y relativa a:

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE SULFATOS DE ALFA-AMINO-ALGUIL-ARILCETONAS Y ALFA-AMINODIOLES, EN ESPECIAL EL SULFATO DE D.L. TREQ+1 P-NITROFENIL-2-AMINO-1,3 PROPANODIOL, o "2 AMINO PARAOXAZOL".

=====



MEMORIA DESCRIPTIVA

La invención presente, tiene por el objeto un procedimiento para la obtención de 2 Amino-pa  
racoxazol, Sulfatos de alfa-amino-alkuil-arilceto  
5 nas y alfa-aminodiolos, en especial el sulfato  
de D,L, treo-1 p-nitrofenil-2-amino-1,3 propano-  
diol.

El producto, obtenido según este procedimien  
to, es por sus propiedades bacteriostaticas y bac-  
10 tericidas, al propio tiempo que antibioticas de  
amplio espectro bacteriano, pueden ser utilizados  
en la elaboración de productos terapeuticos para  
su uso en veterinaria y en medicina humana, tambien  
puede considerarse apto como producto intermedio  
15 para la elaboración del cloramfenicol y derivados  
del mismo.

Con los preparados obtenidos con el produ  
cto de la presente patente se obtienen acabados de  
efectos bactericidas, coccidiostaticos y de gran  
20 actividad fungistatica y tanto en el campo de la  
veterinaria como de la medicina humana, pueden em-  
plearse en uso interno o externo.

En esta patente se describe el método de  
preparación del sulfato de D,L, treo 1, p-nitro-  
25 fenil-2-amino, 1,3 propanodiol partiendo de acri-  
lo-fenonas sustituidas o no, y particularmente de  
la p-nitro acetofenona.

Consiste el procedimiento en una sacuencia  
de reacciones, en que partiendo de la halogenación,  
30 el producto resultante es tratado con aminas débi-  
les totalmente sustituidas, a fin de obtener un  
complejo que posteriormente se hidroliza con acidos  
fuertes, tales como Clorhidrico, Sulfurico, Cloro  
sulfónico, etc.



35 La originalidad del presente procedimiento con-  
 siste, en que sin necesidad de aislar los produc-  
 tos intermedios, el producto resultante de la halo-  
 genación se trata con bases terciarias y el soli-  
 do resultante, en medio acuoso o no acuoso, se  
 40 hidroliza con ácidos, aislandose el producto men-  
 cionado.

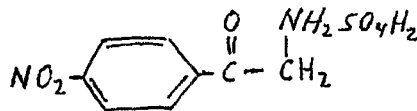
Lo anteriormente citado representa un gran  
 abaratamiento en las instalaciones, por cuanto se  
 elimina el trasiego de muchos productos.

45 El producto aislado se acila tamponando el  
 medio con sales de ácidos débiles, como acético,  
 propionico etc.

Para facilitar la mejor comprensión del pro-  
 ceso indicado, se describen seguidamente dos ejem-  
 50 plos practicos de realización del mismo, los cua-  
 les deben ser considerados como tales y sin carac-  
 ter limitativo.

EJEMPLO 1.-

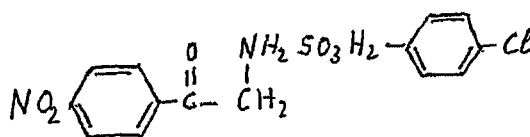
12 gramos del complejo trietil aminico de  
 55 p-nitro acetofenona, se suspenden en una solución  
 sulfurica, a 50 -80 °C. y despues la solución re-  
 sultante se enfria a 15-20°C. y se añade lentamen-  
 te y con buena agitación, 60 gramos de ácido sul-  
 furico de densidad 1,8, al cabo de unos minutos  
 60 cristalizan 10 gramos de un solido blanco amari-  
 llento muy cristalino y de F= 236-243 °C ( $\alpha$ )<sub>D</sub><sup>20</sup>=34,6°  
 (c= 4% - NaOH 0 -1 N).





EJEMPLO 2.-

65 25 gramos del complejo de diemetil-etil-  
 amina de la p-nitro acetofenona se suspende en  
 acido clorosulfonico, se calienta a 28-30°C. se  
 añade despues ácido clorosulfonico, abandonando el  
 producto 24 horas, cristaliza un solido en forma  
 de agujas de F= 174-176 °C.  $[\alpha]_D^{20} = -57.3^\circ$  (c=25% en  $C_5N_5M$ )



70 Descrietas suficientemente las caracteris-  
 ticas fundamentales del procedimiento a que se  
 refiere esta Patente se hace constar que en el mis-  
 mo se podran introducir todas aquellas modificacio-  
 nes que la experiencia, la practica y la tecnica  
 75 pudieran aconsejar, siempre que con ellas no se  
 cambie, altere o modifique su idea fundamental que  
 es la que se resume y concreta en la siguiente:

NOTA

80 Se declaran de novedad y propiedad para  
 todo el territorio nacional las siguientes:

REIVINDICACIONES

1ª.-Procedimiento de obtención de sulfatos de alfa-  
 amino-alquil-arilcetonas y alfa-aminodiolos, en  
 especial el sulfato de D,L, treo-1 p-nitrofenil-2-  
 85 amino-1,3 propanodiol, o "2 amino paraoxazol que  
 se caracteriza en que partiendo de la halogenación,  
 el producto resultante es tratado con aminas débi-  
 les totalmente sustituidas, a fin de obtener, un  
 complejo que posteriormente se hidroliza con aci-  
 90 dos fuertes, tales como Clorhidrico, Sulfurico,  
 Cloro sulfónico, etc.

2ª.-Procedimiento de obtención de sulfatos de alfa-



amino-alquil arilcetonas y alfa-aminodiolos, en especial el sulfato de D,L, treo-2- p-nitrofenil-2-amino-1,3 propanodiol, o "2 amino paraoxazol según la nota anterior que se caracteriza tambien en que sin necesidad de aislar los productos intermedios, el producto resultante de la halogenación se trata con bases terciarias y el solido resultante, en medio acuoso o no acuoso, se hidroliza con ácidos, aislandose el producto mencionado.

3ª.-Procedimiento de obtención de sulfatos de alfa-amino-alquil-arilcetonas y alfa-aminodiolos, en especial el sulfato de D,L, treo-1 p-nitrofenil-2-amino-1,3 propanodiol, o "2 amino paraoxazol según las notas anteriores que se caracteriza tambien en que el producto aislado se acila tamponando el medio con sales de ácidos débiles, como acético, propionico u otras analogos.

4ª.-"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE SULFATOS DE ALFA-AMINO-ALQUIL-ARILCETONAS Y ALFA-AMINODIOLES; EN ESPECIAL EL SULFATO DE D,L, TREO-1 P-NITROFENIL +2ª AMINO-1,3 PROPANODIOL, o "2 AMINO PARAOXAZOL.

Todo ello tal y como ha quedado descrito y reivindicado en la presente memoria que consta de cinco hojas foliadas y mecanografiadas por una sola de sus caras.

Madrid, 12 de Junio de 1.967

ESTADO LIBRE ASOCIADO DE PUERTO RICO  
 DEPARTAMENTO DE ECONOMIA Y FINANZAS  
 Oficina de Patentes y Marcas Registradas  
 (Signature)  
 Director General de Patentes y Marcas Registradas