



Case E 4-2404/MA 1261<sup>+</sup>

342.152

**342 152**

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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVOS DERIVADOS NITRO-FURILICOS", a favor de la firma suiza J. R. GEIGY, A. G., residente en BASILEA (Suiza).

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

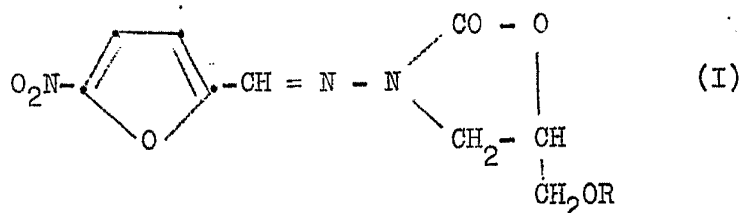
La presente invención se refiere a un procedimiento para la preparación de nuevos derivados nitrofurílicos de oxazolidininas, activos farmacéuticamente, en especial de 5-nitro-2-furfurilidenamino-oxazolidinonas

5. de la fórmula general I

**POOR  
QUALITY**



342152



5. en la que
- R significa un grupo alquílico con 1-12 átomos de carbono, un grupo alquenílico con 3-6 átomos de carbono, un grupo cicloalquílico con 3-10 átomos de carbono de anillo, un grupo alcoxialquílico o alcoxialcoxialquílico, un grupo bisalcoxialquílico o un grupo alqueniloxialquílico, en donde cada uno de los radicales R citados no contienen más de 12 átomos de carbono y cada parte alqueniloxi contiene de 3 a 6 átomos de carbono.
- 10.
- 15.
- 20.
- Cuando R significa un grupo alquílico, uno de estos grupos puede ser por ejemplo, un grupo metílico, etílico, n-propílico, isopropílico, n-butílico, isobutílico, butílico secundario, tercibutílico, n-amílico, isoamílico, n-hexílico, n-octílico, iso-octílico, n-dodecílico o n-dodecílico. Sin embargo son en especial ventajosos los grupos alquílicos de cadena rectilínea



# 342152

ramificada con 1 a 6 átomos de carbono, en especial con 1 a 4 átomos de carbono.

5. Si R significa un grupo alquénico, puede tratarse, por ejemplo del grupo alílico, 2-metalílico, 2-butenil-(crotilico), 3-butenílico, 1-pentenílico, 2-pentenílico o 1-hexenílico. Sin embargo, son especialmente ventajosos los grupos alquénicos de cadena rectilínea o ramificada con de 3 a 4 átomos de carbono.
10. Si R significa un grupo cicloalquílico, se trata por ejemplo del grupo ciclopropílico, ciclobutílico, ciclopenténico, ciclohexílico, cicloheptílico, ciclooctílico o ciclodecílico, pero de preferencia un grupo cicloalquílico con de 3 a 6 átomos de carbono.
15. Si R significa un grupo alcoxialquílico, alcoxialcoxialquílico o un grupo dialcoxialquílico, puede tratarse por ejemplo del grupo metoxietílico, etoxietílico, n-propoximetílico, isopropoximetílico, n-butoximetílico, isobutoximetílico, butoximetílico secundario, tercibutoximetílico, n-pentoximetílico, n-hexiloximetílico, n-octiloximetílico, iso-octiloximetílico, n-decilo-ximetílico, n-dodecilo-ximetílico, 1-metoxietílico, 1-etoxietílico, 1-n-propoxietílico, 1-isopropoxietílico, 1-n-butoxietílico, 1-tercibutoxietílico, 2-metoxietílico, 2-etoxietílico, 2-n-propoxietílico, 2-isopropoxietílico,
- 20.
- 25.



= 4 =

342152

- 2-n-butoxietílico, 2-tercibutoxietílico, 2-n-hexiloxi-  
etílico, 2-n-deciloxietílico, 1-metoxipropílico, 1-eto-  
xipropílico, 2-metoxipropílico, 2-etoxipropílico, 3-me-  
toxipropílico, 3-etoxipropílico, 1-metil-1-metoxi-etíli-  
co, 1-metil-1-etoxi-etílico, 1-metil-2-metoxi-etíli-  
co, 1-metil-2-etoxi-etílico, dimetoxi-metílico, 1:1-  
dimetoxietílico, 1:2-dimetoxietílico, 2:2-dimetoxietíli-  
co, 1:1-dimetoxipropílico, 1:2-dimetoxipropílico, 1:2-  
dimetoxipropílico, 1:3-dimetoxipropílico, 2:2-dimetoxi-  
propílico, 2:3-dimetoxipropílico, 3:3-dimetoxipropí-  
lico, 1-metil-1:2-dimetoxietílico, 1-metil-2:2-dimeto-  
xietílico o dimetoximetilmetílico.

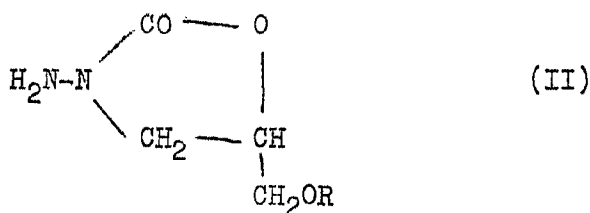
- Si R significa un grupo alqueniloxialquílico, se  
trata en la parte alquénica, por ejemplo de un grupo  
alílico, 2-metalílico, 2-butenil-(crotilico), 3-bute-  
nílico, 1-pentenílico, 2-pentenílico o 1-hexenílico,  
sin embargo son ventajosos especialmente como sustituyen-  
tes finales, grupos alquénicos de cadena rectilínea  
o ramificada con de 3 a 4 átomos de carbono. De esta  
forma R puede ser por ejemplo un grupo aliloximetíli-  
co, 2-aliloxietílico, 3-aliloxipropílico, 4-aliloxibutí-  
lico, 5-aliloxipentílico, 6-aliloxihexílico, 7-aliloxi-  
heptílico, 8-aliloxioctílico, 9-aliloxinonílico, 2-  
metaliloxi-metílico, crotiloximetílico, 3-buteniloxime-  
tílico, 1-penteniloximetílico, 2-penteniloxinotílico o  
1-hexeniloximetílico.



# 342152

Para la preparación de una 5-nitro-2-furfurilidena-  
mino-oxazolidinona de la fórmula I se condensa el 5-  
nitro-2-furfurol o uno de sus derivados funcionales con  
la oxazolidinona correspondiente de la fórmula II

5.



10. o una sal de un ácido inorgánico u orgánico,  
en la que R tiene la significación precedente.

15. Si se utiliza una sal de la oxazolidinona de la  
fórmula II en el procedimiento según la invención, pue-  
de tratarse por ejemplo de una sal del ácido clorhídrico,  
ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico,  
ácido metánsulfónico, ácido metandisulfónico, ácido  
acético, ácido tricloroacético, ácido oxálico, ácido  
succínico, ácido málico, ácido fumárico, ácido maleico,  
ácido tartárico, ácido cítrico o ácido mandélico.

20. Si se utiliza como agente reaccional en lugar  
de 5-nitro-2-furfurol un compuesto que libera 5-nitro-  
furfurol bajo las condiciones reaccionales existentes,  
este puede administrarse como material de partida para  
la preparación de 5-nitro-2-furfurol, como por ejemplo

342152



el diacetato u otro derivado funcional de 5-nitro-2-furfuroil.

- El procedimiento se realiza convenientemente de forma que los reaccionantes se calientan juntos en el disolvente orgánico. El disolvente de preferencia utilizado se concentra en forma esencialmente inerte bajo las condiciones reaccionales y puede ser por ello, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, n-butanol u otro alcohol inferior o una mezcla de dos o varios de ellos o benceno, tolueno o bien otros disolventes aromáticos o una mezcla de dos o varios de ellos. La reacción puede acelerarse en caso deseado de forma que la mezcla reaccional contenga ácido clorhídrico y/o mineral acuoso o ácido acético glacial.
5. La oxazolidinona de la fórmula II utilizada en el procedimiento según la invención, puede prepararse mediante cierre del anillo de un compuesto 1-hidrazino-2-hidroxi-propánico correspondiente, sustituido en posición 3, según métodos conocidos, por ejemplo mediante reacción del carbonato dietílico y un alcoholato sódico. La propia oxazolidinona no precisa aislarse y el reaccionante de la fórmula II puede utilizarse según la preparación por cierre de anillo como producto intermedio, en caso deseado tras purificación parcial.
- 10.
- 15.
- 20.
- 25.

342152



- Los compuestos según la invención, de acuerdo con la fórmula general I poseen propiedades farmacológicas útiles y en especial antimicrobianas y representan un agente antibacterico, antihelmintico, coccidiostático, y tripanocida y un agente contra la materia de significación en la medicina humana y veterinaria. Como especialmente valiosos se muestran los compuestos en el tratamiento de infecciones del tracto intestinal o urinario. Además pueden utilizarse para proteger materias hidrofobas u otras materias orgánicas con peso molecular elevado, que se someten a descomposición por bacterias u otros microbios, por lo cual estas materias se unen con los compuestos, se impregnan o se tratan de otra forma. Los compuestos también hallan utilización como aceleradores de crecimiento en piensos para animales.
- 5.
- 10.
- 15.

- De acuerdo con la invención también se obtiene una combinación de materia terapéutica, que consta de una parte de actividad antimicrobiana de una 5-nitro-2-furfurilidnamino-oxazolidinona de la fórmula I y un vehículo sólido o diluyente líquido admisible farmacológicamente.
- 20.

- Las combinaciones de materias farmacéuticas según la invención, contienen por lo menos un compuesto de la fórmula general I como materia activa junto con vehículos farmacéuticos usuales. La clase de los vehículos se determina vastamente según la zona de aplicación. Para
- 25.



342152

- la aplicación exterior, por ejemplo para la desinfección de la piel sana, como también para desinfección de heridas y para tratamiento de dermatosis e infecciones de mucosas, que son originadas por bacterias, pueden entrar en consideración. en especial pomadas, polvos, tinturas. Las bases para pomadas pueden ser exentas de agua, por ejemplo a partir de mezclas que constan de lanolina y vaselina, o puede tratarse asimismo de emulsiones acuosas, en las que se suspende la materia activa. Como vehículos para polvos son apropiados, por ejemplo, almidones, como almidón de arroz, que en caso deseado pueden hacerse específicamente más ligeros por ejemplo, mediante adición de ácido silícico altamente disperso, o hacerse más pesados mediante adición de talco.

- Las tinturas contienen por lo menos una materia activa de la fórmula general I en etanol acuoso, en especial del 45 al 75%, al que se adiciona eventualmente de 10 a 20% de glicerina. En especial para la desinfección de la piel sana pueden entrar en consideración asimismo soluciones, que se elaboran con ayuda de disolventes usuales, como por ejemplo polietilenglicol, así como eventualmente emulgentes. El contenido de materia activa de las formas de aplicación externa arriba citadas se halla de preferencia entre 0,1 y 5%



# 342152

- Para la desinfección de la boca y de la garganta son apropiados, por una parte, gargarismos o bien concentrados para su elaboración, en especial emulsiones alcohólicas con aproximadamente del 1 al 5% de contenido en materia activa, a los que puede adicionarse glicerina y/o materias aromáticas, y por otra parte, tabletas para chupar, es decir formas unitarias de dosis sólidas con un contenido relativamente elevado en azúcar o en materias similares y un contenido en materia activa relativamente bajo de aproximadamente 0,2 a 20%, así como los aditivos usuales como excipientes y materias aromáticas.
- 5.
- 10.

- Para la desinfección de los intestinos y para el tratamiento oral de infecciones del trato urinario, pueden entrar en consideración en especial formas de dosificación unitaria sólidas, como tabletas, grageas y cápsulas, que contienen de preferencia entre el 10 y el 90% de una materia activa de la fórmula general I, para facilitar la administración de dosis diarias entre 0,1 y 2,5 g en hombres adultos o en dosis reducidas apropiadas para niños. Para preparación de tabletas y núcleos de grageas se combina la materia activa de la fórmula general I, con vehículos sólidos en forma de polvo, como lactosa, sacarosa, sorbita, almidón de maiz, almidón de patata o amilopectina, derivados de
- 15.
- 20.
- 25.



342152

- celulosa o gelatina, de preferencia bajo adición de lubricantes, como estearato magnésico o cálcico o polietilenglicoles de peso molecular apropiado. Los núcleos de gragea se recubren a continuación, por ejemplo con
5. soluciones de azúcar concentradas, que pueden contener, por ejemplo todavía goma arábiga, talco y/o anhídrido titánico, o con una laca disuelta en disolventes o mezclas de disolventes orgánicos fácilmente fluidificables. A estos recubrimientos se puede adicionar colorantes,
10. por ejemplo para la determinación de dosis de materia activa diferentes. Las perlas y otras cápsulas cerradas constan como por ejemplo, de una mezcla de gelatina y glicerina y contienen, por ejemplo, mezclas de una materia activa de la fórmula general I con polietilenglicol. Las cápsulas abribles, contienen, por ejemplo,
15. granulados de una materia activa con vehículos sólidos, en forma de polvo, como por ejemplo lactosa, sacarosa, sorbita, manita; almidones, como almidón de patata, almidón de maíz o amilopectina, derivados de celulosa
20. o gelatina, así como estearato magnésico o ácido esteárico.

En todas estas formas de utilización pueden aplicarse los compuestos de la fórmula general I como materias activas exclusivas, pero asimismo pueden combinarse con otras materias conocidas antimicrobianas,

25.

342152



- en especial antibaetéricas y/o antimicóaticas, por ejemplo, para la difusión de la zona de aplicación. Pueden combinarse, por ejemplo, con 5,7-dicloro-2-metil-8-quinolinol u otros derivados de 8-quinolinol, con
5. sufamerazina o sulfafurazol u otros derivados de sulfamolamida con cloranfenicol o tetraciclina u otros antibióaticos, con 3,4',5-tribromosalicilánilida u otras salicilanilidas halogenadas, con carbanilidas halogenadas, con benzoxazoles o benzoxazolonas halogenadas, con polidloro-hidroxi-difenilmetano, con
10. sulfuros halogeno-dihidroxi-difenílicos, con éteres 4,4'-dicloro-2-hidroxi-difenílicos o éteres 2',4,4'-tricloro-2-hidroxi-difenílico u otros éteres polihalogenohidroxi-difenílicos, o con compuestos cuaternarios
15. bacterianos o con derivados de ácido ditiocarbámicos desecados, como disulfuro de tetrametil-tiuram. Pueden utilizarse como materias de vehículo, que poseen por sí mismas propiedades farmacológicas apropiadas, como por ejemplo azufre, como base de polvo o estearato de cinc
20. como un componente de la base para ungüentos.

Finalmente, la invención provee asimismo un procedimiento para proteger materias orgánicas expuestas al ataque mediante bacterias u otros microbios, que se caracteriza porque las materias se tratan con un 5-nitro-2-furfurilidenamino-oxazolidinona de la fórmula I.

25.



342152

5. La materia orgánica puede ser por ejemplo un material polímero natural o sintético, una sustancia conteniendo proteína o conteniendo hidrato de carbono o una materia textil o fibrosa sintética o natural preparada a partir de esta sustancia.

10. De acuerdo con la invención se obtiene asimismo una composición de pienso para animales, que contiene 5-nitro-2-furfurilidenamino-oxazolidinona de la fórmula I en dosis suficientes para favorecer el desarrollo del animal con ayuda de la composición de materia.

Los ejemplos siguientes aclaran más de cerca la invención. Las temperaturas se indican en grados Celsius.



# 342152

## EJEMPLO 1

- 67 g de carbonato dietílico y una solución de 4,9 g de sodio en 100 cc de metanol exento de agua se adicionan a 60,3 g de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano.
5. La mezcla se calienta durante 3 horas a 120° C. Durante este tiempo se arrastra por destilación metanol y etanol. El residuo se disuelve en 200 cc de ácido acético glacial y se adicionan 30 g de 5-nitro-2-furfurol. Al reposar se separan cristales amarillo, que se fil-
10. tram y se secan.

Como producto se obtiene la 5-etoximetil-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 175°, tras recristalización en etanol.

## EJEMPLO 2

15. Se efectúa el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-n-propoxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano, con lo cual permanecen en esencia las mismas condiciones reaccionales.
20. Como producto se obtiene tras recristalización en etanol, la 3-(5-nitro-furfurilidenamino)-5-n-propoximetil-2-oxazolidinona, punto de fusión 148°



342152

EJEMPLO 3

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-isopropoxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano, con lo cual permanecen esencialmente las mismas condiciones reaccionales.

5.

Como producto se obtiene bajo recristalización en etanol, la 5-isopropoximetil-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 156°.

10.

EJEMPLO 4

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1, bajo utilización de 3-n-butoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano con lo cual permanece en esencia las mismas condiciones reaccionales.

15.

Como producto se obtiene, tras recristalización en etanol, la 5-n-butoximetil-3-(5-nitro-furfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 143°.



342152

EJEMPLO 5

5. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-isobutoxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano, con lo cual permanecen en esencia las mismas condiciones reaccionales.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-isobutoximetil-3-(5-nitro-furfurilidnamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 171°.

10.

EJEMPLO 6

15. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-metoxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano con lo cual permanecen esencialmente las mismas condiciones reaccionales.

Como producto se obtiene tras recristalización en etanol, la 5-metoximetil-3-(5-nitrofurfurilidonamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 188°.

EJEMPLO 7

342152



5. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-1-iso-octiloxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano con lo cual son en esencia las mismas las condiciones reaccionales.

10. Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 3-(5-nitrofurfurilidenamino)-5-iso-octiloximotil-2-oxazolidinona, punto de fusión 103°.

EJEMPLO 8

15. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1 bajo utilización de 3-ciclohexil-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 3-étoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano, con lo cual son en esencia las mismas las condiciones reaccionales.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-cicloheximotil-3-(5-nitrofurfurilidon-amino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 177°.



# 342152

## EJEMPLO 9

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 1, bajo utilización de 3-aliloxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 3-etoxi-1-hidrazino-2-hidroxi-propano, con lo cual son esencialmente las mismas las condiciones reaccionales.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-aliloximetil-3-(5-nitrofurfurildenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 141º.

## 10. EJEMPLO 10

A 12 g de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-metoxi-propano se adiciona 15,5 g de carbonato dietílico, 20 cc de metanol y 1,1 g de metilato sódico. La mezcla se calienta paulatinamente durante 3 horas a 120º. Durante este tiempo se destila metanol y etanol. El residuo se disuelve en 50 cc de ácido clorhídrico 2n y a la mezcla reaccional se adicionan 12,2 g de diacetato de 5-nitro-2-furfural. La mezcla se agita y calienta bajo reflujo durante 45 minutos. Tras el enfriado y reposo, precipitan cristales amarillos que se filtran y se secan.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-metoximetil-3-(5-nitro-furfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 188º. Es idéntico como el producto obtenido del ejemplo 6.



342152

EJEMPLO 11

- A 73,7 g de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietil)propano se adicionan 67 g de carbonato dietílico y una solución de 4,9 g de sodio en 100 g de metanol exento de agua. La mezcla se calienta paulatinamente durante 3 horas a 120°. Durante este tiempo se arrastra por destilación metanol y etanol. El residuo se disuelve en 200 g de ácido acético glacial y se trata con 30 g de 5-nitro-2-furfurol. En el reposo y tras la dilución del disolvente con agua precipitan cristales amarillos que se filtran y secan.
- 5.
- 10.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-metoxietoximetil)-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona con el punto de fusión de 150°

15. Ejemplo 12

- El procedimiento descrito en el ejemplo 15 se realiza bajo utilización de 3-(2-etoxietoxi)-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual con las mismas las condiciones reaccionales.
- 20.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-etoxietoximetil)-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona pura, punto de fusión 125°.



342152

EJEMPLO 13

5. El procedimiento descrito en el ejemplo 15 se realiza bajo utilización de 3-(2-butoxi-etoxi)-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-etoxi)-propano con lo cual las condiciones reaccionales con las mismas.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-butoxi-etoximetil)-3-(5-nitro-furfurilindenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 78°.

10. EJEMPLO 14

15. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-1-metil-etoxi)-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-etoxi)-propano, con lo cual las condiciones reaccionales son esencialmente las mismas.

Como producto final se obtiene tras la recristalización en metanol, la 5-(2-metoxi-1-metiletoximetil)-3-(5-nitro-furfurilidenamino)-2-oxazolidinona pura con el punto de fusión de 105°.



342152

EJEMPLO 15

5. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 3-(2-etoxi-1-metil-etoxi)-1-hidrazino-2-hidroxipropano en lugar de 1-hidrazino-1-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual son esencialmente las mismas condiciones reaccionales.

10. Como producto final se obtienen tras la recrystalización en metanol, la 5-(2-etoxi-1-metil-2-etoximetil)-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona pura con el punto de fusión de 91°.

EJEMPLO 16

15. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 3, bajo utilización 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(1-metil-2-propoxietoxi)-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(metoxietoxi)-propano con lo cual son esencialmente las mismas las condiciones reaccionales.

20. Como producto final se obtiene tras la recrystalización en metanol, la 5-(1-metil-2-propoxi-etoximetil)-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 87°.



342152

EJEMPLO 17

5. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 3-(2-isopropoxi-1-metil-etoxi)-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-etoxi)-propano, con lo cual son esencialmente las mismas las condiciones reaccionales.

10. Como producto final se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-isopropoxi-1-etil-etoximetil)-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-oxazolidinona con el punto de fusión de 92°.

EJEMPLO 18

15. Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 3-(2-aliloxi-1-metil-etoxi)-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual las condiciones reaccionales son especialmente las mismas.

20. Como producto final se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-aliloxi-1-metiletoximetil)-2-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona con el punto de fusión de 76°.



342152

EJEMPLO 19

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-1-metoxi-metiletoksi)-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxi-etoxi)-propano, con lo cual las condiciones reaccionales son esencialmente las mismas.

Como producto se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-(2-metoxi-1-metoxietoxi-etoximetil)-3-(5-nitro-furfurilidenamino)-2-oxazolidinona, punto de fusión 101°.

EJEMPLO 20

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-[2-(2-metoxietoxi)-etoxi]-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual las condiciones reaccionales son esencialmente las mismas.

Como producto se obtiene tras la recristalización en metanol la 5-[2-(2-metoxietoxi)-etoximetil]-3-(5-nitrofurfurilidenamino)-2-oxazolidinona con el punto de fusión de 101°.



342152

EJEMPLO 21

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 3-[2-(2-etoxietoxi)-etoxi]-1-hidrazino-2-hidroxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual la solución reaccional son esencialmente las mismas.

Como producto final se obtiene tras la recristalización en etanol, la 5-[2-(2-etoxietoxi)-etoximetil]-3-(5-nitrofurfurilidonamino)-2-oxazolina con el punto de fusión de 36°.

EJEMPLO 22

Se realiza el procedimiento descrito en el ejemplo 15 bajo utilización de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-metoximetoxi-propano en lugar de 1-hidrazino-2-hidroxi-3-(2-metoxietoxi)-propano, con lo cual las condiciones reaccionales son esencialmente las mismas.

Como producto final se obtiene la 5-metoximetoximetil-3,5-nitro-furfurilidonamino)-2-oxazolidinona.

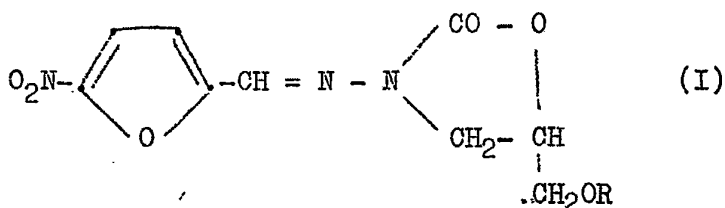


342152

NOTA

Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patente británica núm. 27 818/66 del 22 de Junio de 1966.

- 5. 1. Procedimiento para la preparación de nuevos derivados nitro-furílicos, en especial de 5-nitro-2-furiliden-amino-oxazolidinona de la fórmula general I



10.

en la que

15.

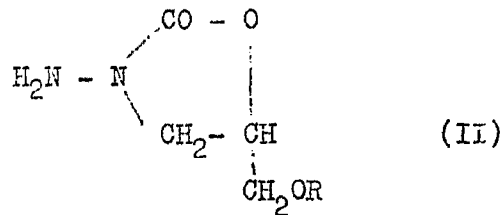
R significa un grupo alquílico con 1-12 átomos de carbono, un grupo alquénílico con 3-6 átomos de carbono, un grupo cicloalquílico con 3-10 átomos de carbono del anillo, un grupo alcoxialquílico o alcoxialcoxialquílico, un grupo bisalcoxialquílico o alqueniloxialquílico, en donde cada radical R citado no contiene más de 12 átomos de carbono y cada parte alqueniloxi contiene de 3 a 6 átomos de



342152

carbono, caracterizado porque se condensa 5-nitro-2-furaldehido o uno de sus derivados funcionales con la oxazolidinona correspondiente o una de sus sales con un ácido orgánico o inorgánico de la fórmula general II

5.



en la que

10.

R tiene la significación arriba indicada.

2. Procedimiento para la preparación de nuevos derivados nitro-furilicos.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 25 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

15.

Madrid, a 21 de Junio de 1967  
p.a.

  
Firmado: JOSÉ RODRIGUEZ