

Cas 4 Orgamol
EX-CH

345265



345265

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 España,
sus territorios y plazas de soberanía, a
favor de:

LABORATOIRES OM S.A.

entidad suiza, domiciliada en 25, rue du
Vieux-Billard, Genève, Suiza, relativa a:

"PROCEDIMIENTO PARA LA FABRICACION DE 5-
(O-METOXIFENOXIMETIL)-2-OXAZOLIDINONA"

=====

Inventor: Laszlo Baum

Prioridad: Solicitud de patente en Suiza
nº 15 504/66 de fecha 25 octu
bre 1966.

3



345265

MEMORIA DESCRIPTIVA

La 5-(o-metoxifenoximetil)-2-oxazolidinona representa un valioso medicamento para la relajación de los músculos del esqueleto. Para su obtención se publicaron varias patentes y publicaciones científicas. Los procedimientos más económicos utilizan como materiales de partida 3-(o-metoxifenoxi)-1,2-propanodiol y urea, que se hacen reaccionar a 180-220°C en presencia o ausencia de un catalizador, como alcoholato sódico y similares. - - - - -

5. En una comunicación científica (Lunsford et al., Am. Soc. 82, 1166 - 71 (1960)) se describe en detalle el curso de la reacción de esta síntesis. Según los resultados obtenidos, se forma en la reacción entre el 3-(o-metoxifenoxi)-1,2-propanodiol y la urea, junto con el producto principal 5-(o-metoxifenoximetil)-2-oxazolidinona, también el producto 5-(o-metoxifenoximetil)-2-dioxolona, que entonces ya no reacciona con la urea, y que es por lo tanto la causa de una disminución del rendimiento. - - - - -

10. Se ha descubierto ahora, que partiendo de esta 5-(o-metoxifenoximetil)-2-dioxolona se puede obtener la oxazolidinona mediante la reacción con urea, consiguiéndose un

345265



rendimiento excelente. Para este fin se hace reaccionar la 5-(o-metoxifenoximetil)-2-dioxolona con la urea convenientemente ya a 170°C aproximadamente, utilizando preferentemente metilato sódico como catalizador. - - - - -

5. EJEMPLO

Se disuelven 1,65 gramos de sodio metálico en 24 cm³ de metanol. A esta solución se añaden a 20°C 112 gramos de 5-(o-metoxifenoximetil)-2-dioxolona y 100 gramos de urea. Se calienta lentamente la mezcla hasta los 100°C, separándose por destilación el metanol. A continuación se eleva la temperatura hasta los 170°C, y se mantiene esta temperatura durante 12 horas. La reacción se produce mediante desprendimiento de amoníaco. A continuación se deja enfriar hasta los 150°C y se vierte la mezcla de reacción todavía fluida en 400 cm³ de agua. Se enfría hasta los 10°C, se filtra el precipitado y se lava de nuevo con agua fría. - - - - -

Cantidad obtenida: 105 gramos de 5-(o-metoxifenoximetil)-2-oxazolidinona = 98% de la producción teórica, F. : 137 - 141°C.

20. Para su purificación se recristaliza el precipitado partiendo de un disolvente adecuado, como agua, metanol, dioxano, etc. Punto de fusión del producto purificado: 142 - 144°C. Rendimiento: 65 - 75%. - - - - -

N O T A

25. Se declaran de novedad y propiedad para España, sus

345265



territorios y plazas de soberanía, las siguientes: - - - - -

REIVINDICACIONES

5. 1.- Procedimiento para la fabricación de 5-(o-metoxifenoximetil)-2-oxazolidinona, caracterizado por hacer reaccionar 5-(o-metoxifenoximetil)-2-dioxolona con urea en presencia de un catalizador. - - - - -

2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque se utiliza metilato sódico como catalizador.-

10. 3.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque la reacción se efectúa sin disolventes. - - -

4.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque la temperatura de reacción se mantiene entre los 170 y los 175°C. - - - - -

15. 5.- "PROCEDIMIENTO PARA LA FABRICACION DE 5-(O-METOXIFENOXIMETIL)-2-OXAZOLIDINONA". - - - - -

Todo ello conforme se describe y reivindica en la presente memoria que consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por una sola de sus caras.

BARCELONA, -9 SET. 367

P. A. M. CURELL SUÑOL