

4 1 1 6 0 3



P.-53.231

Finnish Pat.

Appln.No.

411/72

9.C. 20-3-75

MEMORIA DESCRIPTIVA

Int. Cl.²: C07C/A61K

para solicitar PATENTE DE INVENCION por 20 años

a nombre de LAAKE OY

entidad finlandesa

establecida en 20360 Turku 36, Finlandia

por: "UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UNA
FENOXIALCANOLAMINA"

(Clase Internacional 007c)

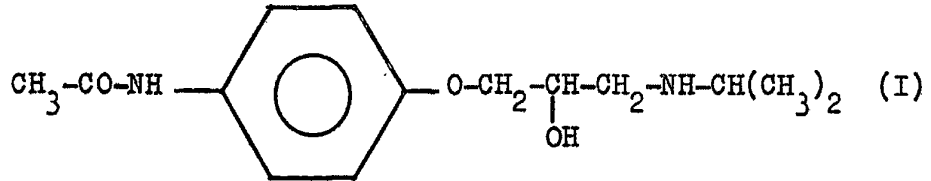
27.2.73

- 1 -



411603

La invención se refiere a un procedimiento para la preparación de 4'-(2-hidroxi-3-isopropilaminopropoxi)-acetanilida que tiene la fórmula

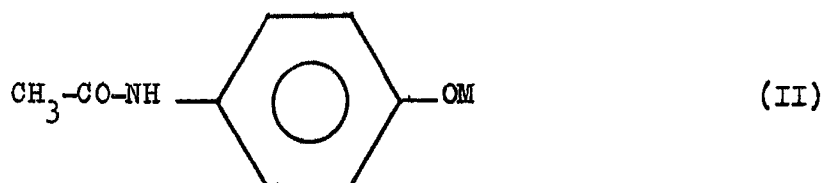


5 Este es un agente de bloqueo beta-adre-
 nérgico relativamente nuevo que fué descrito por
 primera vez en 1968. Sin embargo, ya ha encontra-
 do empleo en el tratamiento de la angina de pecho,
 en arritmias cardiacas de diversos tipos y en el
 10 tratamiento del asma. Debido a sus escasos efectos
 secundarios se considera un medicamento más seguro
 que otros agentes de bloqueo anteriores, por ejem-
 plo, propanolol, (1-isopropilamino-3-(1-naftiloxi)-
 2-propanol).

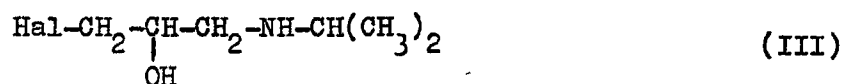
15 La presente invención se refiere a un
 procedimiento, en el que se hace reaccionar una sal
 alcalina de 4-hidroxi-acetanilida, que tiene la fór-
 mula

411603

-5 MAR 1960



en la que M representa un metal alcalino, con 1-halógeno-2-hidroxi-3-isopropilaminopropano, que tiene la fórmula



5 en la que Hal representa cloro o bromo, o con 1,2-epoxi-3-isopropilaminopropano, que tiene la fórmula



10 en un disolvente adecuado. La temperatura es de preferencia, la temperatura ambiente, pero puede ser también más alta. Un disolvente adecuado es un disolvente orgánico polar miscible con agua o la mezcla de éste con agua, o preferiblemente sólo



agua. Cuando la reacción ha concluido el producto de reacción puede aislarse, por ejemplo, saturando la solución con una sal inorgánica tal como carbonato potásico, y extrayendo con un disolvente orgánico tal como cloroformo.

Así pues, el método es muy sencillo. Como los materiales de partida y los disolventes no son costosos y los rendimientos son buenos, aproximadamente 70-80%, el método es asimismo, económico y además el producto se obtiene en estado puro.

La invención se ilustra mediante los ejemplos que no están destinados a limitar la extensión de la invención.

Ejemplo 1

Se disuelven 5,0 g de hidróxido sódico en 30 ml de agua y a esta disolución se añaden 5,0 g de 4-hidroxiacetanilida. Después de esto se añaden a la solución 5,0 g de 1-cloro-2-hidroxi-3-isopropilaminopropano y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante 16 horas. La solución acuosa se satura con carbonato potásico y se extrae con cloroformo. La solución clorofórmica se trata con carbón activo, se filtra y se evapora el disolvente. El

411603



residuo se recristaliza en acetato de etilo. El rendimiento es de 6,2 g = 78 por ciento. Punto de fusión 141°-142°.

Ejemplo 2

5 Se disuelven 5,0 g de hidróxido sódico en 30 ml de agua y se añaden 5,0 g de 4-hidroxiacetanilida. A la solución se añaden 3,8 g de 1,2-epoxi-3-isopropilaminopropano y la mezcla se agita durante 5 horas a una temperatura de 50°. La mezcla
10 de reacción se trata como se ha descrito en el ejemplo 1. El rendimiento de 4'-(2-hidroxi-3-isopropilaminopropoxi)-acetanilida es de 5,75 g = 72 por ciento, punto de fusión 141-142°.

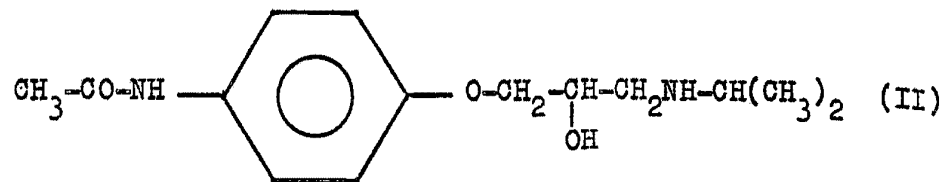
15 Esta solicitud que corresponde a la presentada en Finlandia, el 16 de Febrero de 1972, con el número 411/72, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.



REIVINDICACIONES

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por
 5 VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

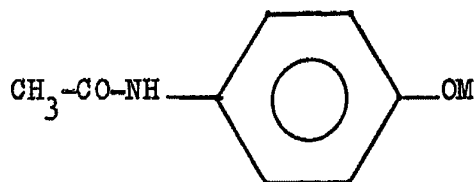
1ª - Un procedimiento para la preparación de una fenoxialcanolamina terapéuticamente valiosa que tiene la fórmula



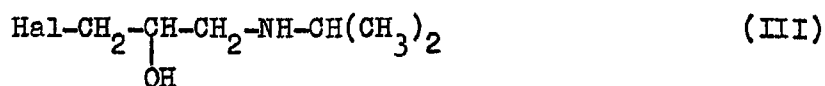
10 que comprende la reacción de la sal alcalina de 4-hidroxiacetanilida que tiene la fórmula

123

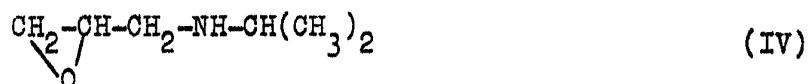
411603



en la que M representa un metal alcalino, con 1-halógeno-2-hidroxi-3-isopropilaminopropano que tiene la fórmula



5 en la que Hal representa Cl o Br, o con 1,2-epoxi-3-isopropilaminopropano que tiene la fórmula



en un disolvente adecuado.

2ª - Un procedimiento según la reivindicación 1ª, en el que se usa como disolvente un disolvente orgánico polar miscible con agua, una
10 mezcla de éste con agua o solamente agua.

3ª - Un procedimiento según la reivindicación 1ª, en el que la temperatura es la tempe-

Ag

411603



ratura ambiente o una temperatura elevada.

4ª - Un procedimiento para la preparación de una fenoxialcanolamina.

5 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de ocho hojas escritas a máquina por una sola cara 5 MAR. 1973

Madrid,

P.A.

Alberto de Elizaburu
Per Federn

Py

27.2.73
JJV