

492400



P.- 53.275

492400

MEMORIA DESCRIPTIVA

Int. Cl. <sup>2</sup> <u>C07D</u>
-----------------------------------

para solicitar PATENTE DE INVENCION por VEINTE años

a nombre de LABORATORIOS MADE, S.A.

entidad española

con domicilio en Avenida de Burgos, Km. 5,850, Madrid.

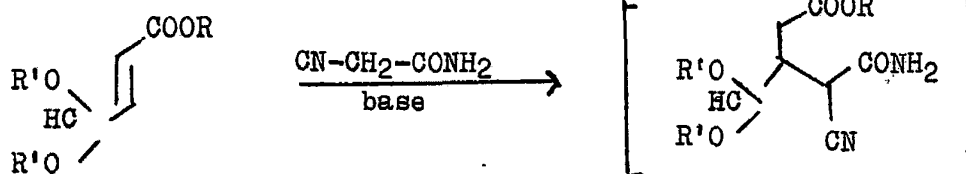
por: "UN PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE 2-CIANO-3-DIALCO  
XIMETILGLUTARIMIDAS" (Clase Internacional C07d)



El objeto del presente invento es la fabrica-  
ción de la 2-ciano-3-dialcoximetilglutarimida (II) com-  
puesto de interés para la industria química y especial-  
mente química-farmacéutica.

5 El procedimiento de fabricación, se fundamen-  
ta en una adición de Michael de la cianacetamida al áci-  
do 3-formilacrílico en forma de acetal éster en las con-  
diciones de catálisis básica usuales en este tipo de  
reacción.

10

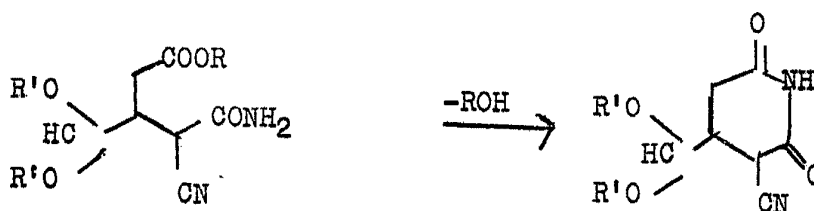


I

15

seguido de posterior ciclación espontánea, en las condi-  
ciones de reacción, con pérdida del correspondiente al-  
cohol

20



II

25

412400



El esquema de síntesis se ilustra con el ejemplo siguiente, que en modo alguno debe considerarse limitativo, en donde  $R=Et$  y  $R'=Et$ .

5 En un matraz de 250 mls provisto de refrigerante de reflujo cerrado por un tubo de  $Cl_2$  Ca, se introducen 100 mls de etanol destilado sobre sodio y 3,45 grs (0,15 moles) de sodio previamente fundido sobre tolueno.

10 Cuando el sodio ha reaccionado por completo se añaden 8,4 grs (0,1 moles) de cianacetamida, y se hierve a reflujo durante 1 hora. Posteriormente se adiciona, en caliente, el 4,4-dietoxicrotonato de etilo: 20,2 grs (0,1 moles). El reflujo se mantiene 15 horas con una agitación vigorosa. Se deja enfriar y se neutraliza con la cantidad exacta de ácido acético glacial, se elimina el disolvente a presión reducida, extrayéndose a continuación con seis porciones de 100 mls de acetato de etilo ó éter etílico. El extracto se seca sobre sulfato magnésico anhidro. Se elimina el disolvente  
15 hasta inicio de cristalización.

20 p.f. 71-72°

Análisis elemental

	Calculado para $C_{11}H_{16}N_2O_4$
	Calculado C 55,15 H 6,59 N 11,76
25	Hallado C 54,99 H 6,71 N 11,66

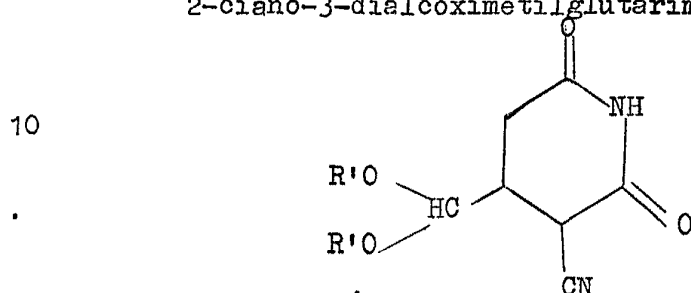


42400



presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España por VEINTE años, son los que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

5                   1ª.- Un procedimiento de obtención de  
2-ciano-3-dialcoximetilglutarimidas de fórmula



en donde R' representa un grupo alquilo inferior, caracterizado porque se efectúa una reacción de adición de Michael entre el ácido 3-formilacrílico en forma de acetal éster y la cianacetamida, con ciclación y pérdida espontánea del alcohol correspondiente.

15

2ª.- Un procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado por utilizar bases orgánicas o inorgánicas como catalizador.

20

3ª.- Un procedimiento de obtención de 2-ciano-3-dialcoximetilglutarimidas.

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

25

400

-8 JUN 1974



Esta Memoria consta de seis hojas escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, - 8 JUN. 1974

P.A.

Quirós

11.3.74/R.A.-

RM