

Case BEY 8653

MILANO
OFFICINA
STAMPES.

Int. Cl. CO 2

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

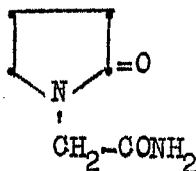
a favor de la firma italiana ISTITUTO SIEROTERAPICO
MILANESE SERAFINO BELFANTI, residente en MILAN (Italia)
Via Darwin 20, por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION
DE 2-OXO-1-PIRROLIDIN-ACETAMIDA".

357

MEMORIA DESCRIPTIVA

El presente invento tiene por objeto un nuevo
procedimiento para la preparación de la 2-oxo-1-pirrolidin-
acetamida (I)

5.



(I)

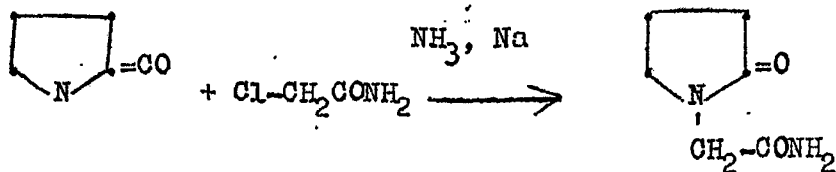
10.

Este compuesto posee una notable importancia terapéutica,
por ejemplo en el tratamiento de formas de hipertensión,
hipercinosis, hipertonia y similares. Este se obtiene,

5. por ejemplo, según la patente británica 1.039.113, por condensación de la 2-pirrolidona con cloroacetato de etilo y sucesiva amonólisis del 2-oxo-1-pirrolidin-acetato de etilo así preparado. Esta síntesis en dos etapas resulta en realidad bastante compleja, ya sea por la necesidad de llevarse a cabo bajo presión en la segunda etapa, ya sea por el prolongado tiempo que requiere la reacción de la amonólisis (3 a 4 días). Según una indicación de la patente citada se puede obtener el compuesto (I) por condensación directa de la alfa-cloroacetamida con 2-pirrolidona en presencia de un hidruro metálico, de por sí costoso, operando en disolventes igualmente costosos como es el dioxano anhidro.

10. Ahora se ha descubierto que la 2-oxo-1-pirrolidin-acetamida (I) puede prepararse de modo mucho más sencillo y económico, con rendimientos elevados, condensando la 2-pirrolidona con alfa-cloroacetamida en presencia de sodio metálico y amoníaco líquido. Es evidente la economía de esta substancia con respecto a la utilizada según la técnica precedente. Por otra parte, el producto que se obtiene después de la evaporación del amoníaco líquido se obtiene en forma pura con una simple cristalización, o sea, de modo sensiblemente más práctico que con cuanto se conoce hasta ahora.

25. El procedimiento del invento, que constituye por consiguiente un notable enriquecimiento de la técnica, se ilustra en el ejemplo que sigue:



5. Se adicionan gradualmente 45 g de 2-pirrolidona en 400 cc de amoníaco líquido a 12 g de sodio metálico y 45 g de cloroacetamida. Se deja la solución durante 5-6 horas a -50°C para que se complete la reacción. Se separa el amoníaco por evaporación espontánea y se recoge el residuo con metanol. Después de la filtración y separación del disolvente se cristaliza con etanol al 95%. Se obtienen 60 g, punto de fusión 150-151°C. Análisis para C₆H₁₀N₂O₂ : N calculado = 19,7%, N hallado = 19,3%.
- 10.

- . -
N O T A

15. Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patente italiana nº 24412/A-75 del 16 de Junio de 1975.

20. 1. Procedimiento para la preparación de 2-oxo-1-pirrolidin-acetamida, caracterizado porque se hace reaccionar 2-pirrolidona y alfa-cloro-acetamida en presencia de sodio metálico y amoníaco líquido.

2. Procedimiento para la preparación de 2-oxo-1-pirrolidin-acetamida.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 4 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 27 Septiembre 1975

p.a.:

JAI ME ISE RN

p. p.

Firmado: JOSE L. MORA