

Title (en)
A PROCESS FOR THE PREPARATION OF 3-HYDROXY-ISOXAZOLE.

Title (de)
VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-HYDROXY-ISOXAZOLEN.

Title (fr)
PROCEDE DE PREPARATION DE 3-HYDROXY-ISOXAZOLE.

Publication
EP 0125253 A1 19841121 (EN)

Application
EP 83903381 A 19831025

Priority
• DK 319283 A 19830711
• DK 474282 A 19821026

Abstract (en)
[origin: WO8401774A1] 3-Isoxazolole having the formula (I), wherein R1 designates lower alkyl or substituted lower alkyl, aryl or substituted aryl, and R2 designates hydrogen, lower alkyl or substituted lower alkyl, or R1 forms together with R2 and the carbon atoms, to which they are attached, a ring having 5 to 7 carbon atoms, and tautomers thereof, are prepared in that to an aqueous alkaline solution of hydroxylamine having a pH-value in the range 8 to 12 one adds either a) a beta -keto ester having the formula $R1-CO-CH(R2)COOR3$, where R1 and R2 have the stated meaning, and R3 is an ester-forming group, which may be part of R2, or b) diketene, taking care of quick intermixing with the alkaline solution and of maintenance of the pH-value of the mixture within the stated range during the reaction, as well as of keeping the temperature of the mixture below about 30°C, and that after completion of the reaction of hydroxylamine with beta -keto ester or diketene one mixes the reaction mixture quickly with an excess of aqueous acid to obtain a strongly acid mixture so that 3-isoxazolole is formed as a predominant reaction product, whereupon this product is isolated.

Abstract (fr)
3-isoxazolole de formule (I) où R1 représente un alcoyle inférieur ou un alcoyle inférieur substitué, un aryle ou un aryle substitué, où R2 représente un hydrogène, un alcoyle inférieur ou un alcoyle inférieur substitué, ou R1 forme avec R2 et les atomes de carbone auxquels ils sont fixés un cycle de 5 à 7 atomes de carbone, ainsi que ses tautomères. Ils se caractérisent par le fait que, à une solution alcaline aqueuse d'hydroxylamine de pH entre 8 et 12, on ajoute soit (a) un ester beta-cétonique de formule $R1.CO.CH(R2)COOR3$, où R1 et R2 ont la même signification que ci-dessus et R3 est un groupe de formation d'ester, pouvant être une partie de R2, soit (b) du dicétène, en faisant attention à les mélanger rapidement avec la solution alcaline et à conserver pendant la réaction le pH du mélange dans la fourchette susmentionnée, ainsi qu'à maintenir la température du mélange en-dessous d'environ 30°C; une autre caractéristique est que, après achèvement de la réaction de l'hydroxylamine avec l'ester beta-cétonique ou le dicétène, on mélange le mélange de réaction rapidement avec un excédent d'acide aqueux pour obtenir un mélange fortement acide, de façon que le produit prédominant de réaction soit du 3-isoxazolole; après quoi, on isole ce produit.

IPC 1-7
C07D 261/06; **C07D 261/12**; **C07D 261/20**

IPC 8 full level
C07D 261/12 (2006.01); **C07D 261/20** (2006.01)

CPC (source: EP)
C07D 261/12 (2013.01); **C07D 261/20** (2013.01)

Designated contracting state (EPC)
BE CH DE FR GB LI NL SE

DOCDB simple family (publication)
WO 8401774 A1 19840510; DK 150615 B 19870421; DK 150615 C 19871109; DK 319283 A 19840427; DK 319283 D0 19830711;
EP 0125253 A1 19841121; JP S59501907 A 19841115

DOCDB simple family (application)
DK 8300097 W 19831025; DK 319283 A 19830711; EP 83903381 A 19831025; JP 50346883 A 19831025