



M E M O R I A D E S C R I P T I V A

para una patente de invención por veinte años, por "Procedimiento para la obtención de productos de substitución de la piridina" a favor de la Razón Social Deutsche Gold & Silber Scheideanstalt vorm. Roessler.- Con residencia en Frankfurt a. M. (Alemania) Weissfrankenstrasse 7 /9.

= = = = =

Según el invento se llega a conseguir productos de substitución valiosos de la piridina siendo introducido yodo por vía diazónica en derivados de la piridina. Esto puede verificarse por ejemplo de tal manera que, soluciones diazónicas que por ejemplo pueden ser obtenidas según métodos corrientes de derivados de aminopiridinas sean llevados a reacción con materias que contengan el yodo introducido, como por ejemplo yoduro de potasio.

Si se parte por ejemplo de un derivado del 5- o 3-aminopiridina, se llega por medio de diazoación y tratamiento de la solución diazónica con alcalí de yodo por ejemplo en reacción que se ve-



rifica sin dificultad a cuerpos que llevan al yodo introducido en la posición 5- o 3-respectivamente.

Según el invento se pueden lograr compuestos de yodo y piridina que se distinguen por sus efectos fuertemente bactericidas y especialmente cuando junto con el yodo existen aun substituyentes electronegativos, como por ejemplo el grupo hidroxilo, cloro, &a,. Según esto son elaboradas con ventaja materias de partida tales que lleven substituyentes de la clase mencionada.

E j e m p l o s:

1. 36 gr. de 2-5 clorhidrato de diaminopiridina son disueltos en 150 cm³ de agua y mezclados con 200 cm³ de ácido sulfúrico al 10%. Se diazoa enseguida en la forma corriente por medio de la adición de 14 gr. de una solución de nitrito de sodio y 250 cm³ de agua. En la solución diazoada obtenida se hace correr entonces lentamente una solución de 10 gr. de yoduro de potasio en 40 cm³ de agua. Después de terminada la reacción que se hace notar por fuerte espuma, se hace reposar largo tiempo, eventualmente mediante aumento de temperatura. Enseguida el líquido se hace fuertemente alcalino con lejía de sosa concentrada y se separa con vapor de agua la 2-amino-5-yodopiridina. En este caso se separa el cuerpo en hojitas de cristal blancas, las cuales después de enfriadas son aspiradas del producto de destilación, y después de secadas poseen en el vacío el punto de fusión 129^o. Las partes disueltas aun en el producto de destilación se pueden obtener por ejemplo por medio de extracción con eter.

2. 100 gr. de 2 oxi-5-clorhidrato de aminopiridina son disueltos en 300 cm³ de agua y enseguida mezclados con 300 cm³ de ácido clorhídrico concentrado. La amina es entonces diazoada por medio de la adición de 47 gr. de nitrito de sodio en 200 cm³ de agua en la forma usual. En la solución diazoada se hace correr en chorro delgado una solución de 300 gr. de yoduro de potasio en 350 cm³ de



agua mediante fuerte agitación. Después de esto se calienta por corto tiempo en el baño de María y la mezcla de reacción se deja luego reposar durante varias horas. En este caso se separa un producto de color obscuro el cual, por tratamiento con lejía de sosa concentrada, es convertido en la sal de sodio del 2-oxi-5-yodopiridina. Separada por cristalización del agua se obtiene la sal de sodio en forma pura. Por medio del tratamiento de la sal con ácidos, convenientemente por introducción de ácido carbonico, en la solución acuosa de la sal es precipitada la 2-oxi-5-yodopiridina libre. Punto de fusión 191 - 192^o.

3. 2-cloro-5-aminopiridinas es diazoada en forma usual en solución acida con nitrito de sodio. La solución diazónica obtenida es dada en una solución de yoduro de potasio. La reacción se establece enseguida mediante turbulento desarrollo de nitrogeno. Por medio de la alcalización y destilación con vapor de agua se obtiene la 2-cloro-5-yodopiridina en hojitas blancas de punto de fusión 99^o.

4. 2-oxi-3-aminopiridina es diazoada en forma usual. Por medio del tratamiento de la solución diazónica en la forma descrita en el ejemplo 3 se obtiene la 2-oxi-3-yodopiridina, cuya sal de sodio se presenta en cristales facilmente solubles en el agua.

Se ha obtenido ya cloro-bromo piridina mezclando una mezcla hervida hasta la decoloración de vitriolo de cobre, bromuro de potasio, acido sulfurico y virutas de cobre cloroaminopiridina y después añadiendo solución de nitrito. El compuesto de bromo obtenido de este modo no posee importancia terapéutica. En cambio se llega segun el presente invento a compuestos de yodopiridina que se caracterizan por propiedades bactericidas sorprendentemente elevadas y que poseen tambien gran valor terapéutico.



N O T A.

Descrito suficientemente el presente invento lo que se declara como de novedad e invención propia, son las siguientes reivindicaciones:

1.- Procedimiento para la obtención de productos de sustitución de la piridina caracterizado porque en derivados de la piridina es introducido yodo por vía diazónica, por ejemplo, de tal manera que soluciones diazónicas de los correspondientes derivados de la piridina son transformados con materias ricas en yodo, por ejemplo alcali yódico.

2.- Procedimiento según la conclusión 1, caracterizado porque los derivados de aminopiridina, especialmente los que llevan grupos amino en posición 5- y 3-respectivamente, son diazoados y las soluciones diazoadas obtenidas son transformadas con materias ricas en yodo, por ejemplo alcali yódico.

3.- Procedimiento según las conclusiones 1 a 2, caracterizado porque como materias de partida son empleados aquellos derivados de piridina que contienen substituyentes de naturaleza electronegativa, como por ejemplo el grupo hidroxilo.

4.- Procedimiento para la obtención de productos de sustitución de la piridina.- Según se describe y reivindica en esta memoria descriptiva.

Consta esta memoria descriptiva de cuatro hojas foliadas y es criticas a máquina por una sola cara.

Madrid a 24 de Junio de 1925.

Leocadio López y López

P.P.