



MEMORIA DESCRIPTIVA

para un Certificado de adición, por = Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal. =

a favor de la Razón Social

Deutsche Gold & Silber Scheideanstalt vorm. Roessler, con residencia en Frankfurt a. M. (Alemania) Weissfrauenstr. 7/9.

=====

Por medio de la patente principal ha sido protegido un procedimiento para la obtención de compuestos orgánicos, que consiste en que compuestos diazóticos substituidos o insubstituidos de la serie piridina, quinolina e isoquinolina son llevados a reacción con arsenitos y respectivamente con los ácidos libres de estas sales.

Otras investigaciones han dado por resultado que de igual manera también se puede introducir antimonio por vía diazótica y de esta manera se puede llegar a nuevos compuestos de antimonio de gran valor y de naturaleza heterocíclica. Así por ejemplo, por medio de la influencia de antimonitos o de ácidos antimónicos se puede llegar sobre compuestos diazóticos de la serie piridina quinolina o isoquinolina a los correspondientes ácidos stibínicos.



Las materias de partida, pueden contener substituyentes, especialmente los de caracter electronegativo y tambien substituyentes que actúen terapéuticamente. Como substituyentes pueden ser tomados en consideración, por ejemplo, grupo como los grupos hidroxilos, grupos aminos, grupos acetilaminos, grupos glicilos y además halógenos, etc.

En casos dados pueden introducirse los substituyentes deseados también posteriormente en los compuestos arsenicales formados. Además fué aún encontrado que las sales de los ácidos arsenicos de las series piridina y quinolina, por ejemplo, los compuestos alcalinos se distinguen por una falta de toxicidad sorprendente. Basado en este conocimiento se recomienda convertir los ácidos correspondientes por ejemplo, por medio de neutralización completa o parcial con lejía alcalina, en las sales correspondientes.

La introducción de arsénico en los cuerpos de partida disociados puede hacerse en disolución neutral, ácida o alcalina a temperatura ordinaria o elevada. Se recomienda determinar por ensayos el método mejor en cada caso. Se ha demostrado sin embargo que es ventajoso en general emplear los arsenitos, antimonitos, etc., en exceso y en caso dado en fuerte exceso, por ejemplo, para una molécula de compuesto piridinico o quinolinico diazocado, 2 a 3 moléculas y más de arsenito alcalino. En muchos casos se ha demostrado ventajoso favorecer la reacción por medio de catalizadores, por ejemplo polvo de cobre.

Según una forma de ejecución del invento se llega a otros compuestos convirtiendo los ácidos arsenicos de la serie piridina y quinolina obtenidos según el invento o por otros procedimientos, por medio de tratamiento con medios de reducción, en grados de oxidación más bajos, por ejemplo en los correspondientes óxidos arsenicos o respectivamente en los correspondientes compuestos arsenicos. Como medio de reducción puede tomarse en consideración por ejemplo hidrosulfito, ácido hipofosforico, bisulfitos, etc.

Igualmente, partiendo de los óxidos, por ejemplo óxidos *stibini*
~~arsenicos~~



cos del tipo $RAs = O$, se puede llegar por tratamiento por medio de reducción a los compuestos ~~de estibio~~ ^{de stibio} correspondientes del tipo $RAs = AsR$.

La convertibilidad de los ácidos arsenicos en compuestos arsenicos ofrecen tambien una via comoda para la purificación de los compuestos primeramente nombrados. Se procede, por ejemplo, de tal manera que se pasa según el invento de compuestos diazoicos o de ácidos arsenicos obtenidos de otro modo, por medio del tratamiento por medios de reducción, a los compuestos arsenicos etc, correspondiente y estos ultimos luego se vuelven a transformar por medio del tratamiento por medios de oxidación apropiados, por ejemplo hiperóxido de hidrogeno en los correspondientes ácidos.

Ejemplos:

1º. Una molecula en peso de α -oxi $-\beta'$ -aminopiridina es diazoada en solución ácida con nitrito de sodio. Se hace caer a gotas la solución diazoada en una solución de antimoniato de sodio, despues de lo cual el liquido de reacción hecho ligeramente alcalino se hace reposar largo tiempo para completar la transformación. Del liquido de reacción se puede aislar el ácido stibinico formado por el empleo de los métodos usuales para la obtención de los ácidos stibinicos aromáticos. En este caso se obtiene un polvo pardo amarillo que contiene aún impurezas y que no se funde a temperaturas hasta de 300º. El ácido α -oxi- β' -piridilstibinico es soluble en ácido clorhídrico atenuado y en lejía de sosa atenuada, difícilmente soluble en agua e incoluble en alcohol y en el ácido acético cristalizabile.

2º. El ácido stibinico obtenido en el ejemplo 1º, es sometido bajo cierre neumático a calefacción moderada a la influencia hipofosfórica. Se obtiene α -dioxi- $\beta\beta'$ -stibiopiridina. Este compuesto stibio puede ser oxidado por tratamiento hiperóxido de hidrogeno en el ácido stibinico correspondiente, el cual es obtenido en una forma pura.

El invento hace posible la obtención de nuevos compuestos de antimonio heterociclicos los cuales se distinguen por propiedades



muy valiosas, por ejemplo, por muy buena permanencia, grandes efectos curativos y notable intoxicidad.

N O T A

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

1^a.- Procedimiento para la obtención de nuevos compuestos heterocíclicos según la patente principal número 91.495 caracterizado porque compuestos diazoicos sustituidos o insustituidos de la serie piridina, quinolina o isoquinolina son llevados a reacción antimonitos o respectivamente ácido antimónico.

2^a.- Procedimiento según la conclusión 1, caracterizado porque cuerpos de la serie piridina, quinolina o isoquinolina que contienen sustituyentes de naturaleza electronegativa, como por ejemplo, el grupo hidroxilo, son sometido a la reacción según la conclusión 1.

3^a.- Procedimiento según las conclusiones 1 y 2, caracterizado porque los ácidos stibínicos obtenidos son convertidos en sales, por ejemplo, por medio de neutralización completa o parcial con lejía alcalina.

4^a.- Procedimiento para la obtención de nuevos compuestos heterocíclicos, caracterizado porque ácidos stibínicos como los que por ejemplo pueden ser obtenidos según las conclusiones 1 y 2, son convertidos en grados más bajos de oxidación por medio del tratamiento con medios de reducción.

5^a.- Procedimiento según las conclusiones 1 a 4, caracterizado porque ácidos stibínicos como los que pueden ser obtenidos por ejemplo según las conclusiones 1 y 2 son sometidos a la reducción según la conclusión 1 y los productos de reducción obtenidos son convertidos en grados más elevados de oxidación por medio del tratamiento con medios oxidantes.



6^a.— Mejoras introducidas en el objeto de la patente principal.—
Según se describe y reivindica en esta memoria descriptiva.

Consta esta memoria de cinco hojas foliadas y escritas por una
sola cara.

Madrid 24 de Junio de 1925-

Leocadio López y López.

P.P.=