

166736



-3 JUL 1944

166736

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar

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

en

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de Theodor Hermann Temmler, de nacionalidad alemana, residente en Waldowallee 86 - 88, Berlín-Karlshorst, Alemania, por:

"UN PROCEDIMIENTO DE PREPARAR LACTAMAS α - HALOGENADAS".

- 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 - 0 -

Se ha descubierto que se consigue una nueva clase de combinaciones de gran actividad fisiológica, si en lactamas se introduce un átomo halógeno en el átomo de carbono que está en posición α con el grupo carbonílico. Para obtener las nuevas combinaciones, o bien se pueden emplear como material de partida lactamas que contienen un sustituyente en posición α , que es sustituible por halógeno, como por ejemplo, hidrógeno o el grupo hidroxílico, o bien se puede partir de lactamas halogenadas más altas, que tienen además en el átomo de carbono en α , por lo menos un halógeno, en otros dos átomos de carbono. En este último caso todos



166736

5 todos los átomos de carbono tienen que separarse por reducción y por agentes reductores químicos, salvo el átomo de halógeno α -constante y estable en forma especialmente manifiesta contra la eliminación, por ejemplo, cinc encobrado y ácido clorhídrico, o también se pueden separar con hidrógeno excitado catalíticamente, pudiendo en este último procedimiento citado hidrogenar en su caso simultáneamente o también después las dobles combinaciones de núcleo del anillo lactámico eventualmente existentes.

10

Ejemplos.

15 1) 20 partes de 3,4,5,6,-tetracloropiridona se disuelven en 200 partes de éter y después de añadir un catalizador de platino y carbón se hidrogenan a la temperatura ambiente. Una vez que se ha admitido la cantidad de hidrógeno calculada para 3 mol, se separa por filtración del catalizador. El filtrado se neutraliza por agitación con lejía sódica diluída, y el éter se seca y evapora. El residuo pasa al vacío de 15 mm y 198-200°. El rendimiento de la 3-cloropiridona-(2) obtenida de este modo es casi cuantitativo.

20

25 2) A 25 partes de α -oxicaprolactama se añaden cuidadosamente 40 partes de cloruro tionílico después de haber añadido algo de éter en pequeñas porciones; por calentamiento suave se lleva a término la cloruración, y el cloruro tionílico remanente se destila con el éter. El residuo, después de neutralizado con lejía sódica diluída, se agita con éter, y de la solución etérea seca se obtiene en rendimiento casi cuantitativo la α -clorocaprolactama de Kp_{11} .



166736

167-169°. Se solidifica fácilmente y tiene el punto de fusión de 92°.

3)a) 20 partes de 3,4,5,-tricloropiridona-2 se hidrogenan en 300 partes de ácido acético glacial después de añadir un catalizador de platino y carbón a 3 atm efectivas y a la temperatura ambiente. Después de absorber la cantidad de hidrógeno calculada para 4 mol , se separa del catalizador por filtración y el filtrado se evapora en el vacío. El residuo se alcaliniza débilmente con lejía sódica diluida y se obtiene la α -clorovalerolactama de Kp_{15} 190-192°, F 80° en rendimiento casi cuantitativo.

b) Si la reducción se realiza por medio de reductores químicos, por ejemplo, con cinc encobrado en solución alcohólica con adición de ácido clorhídrico se forma sólo en vestigios el α -cloroderivado del ácido amínico saturado. En cambio el producto principal es el monocloroderivado obtenido según el ejemplo 1, de un ácido amínico doblemente insaturado, el 3-cloropiridona de Kp_{15} 198-200°.

Esta solicitud que corresponde a la presentada en Alemania el 7 de junio de 1943, bajo el número T. 59.226 IVc/12p, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

- O - N O T A - O -

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:



166736

1º. - Un procedimiento de obtener α -monohalógenolactamas, caracterizado porque se monohalogenizan lactamas o derivados de las mismas en posición α por almacenaje, sustitución o eliminación.

5 2º. - Un procedimiento según se reivindica en el punto 1º, caracterizado porque se hidrogenan polihalógenolactamas, que tienen un halógeno, además de en un átomo de carbono en α , por lo menos en otros dos átomos de carbono, pudiendo en su caso saturarse las combinaciones dobles del
10 anillo lactámico eventualmente existentes.

3º. - Un procedimiento de preparar lactamas α -halogenadas.

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

15 Esta Memoria consta de cuatro hojas escritas por una sola cara.

Madrid, -3 JUL 1944

P. A.

Alberto de Euzkadi

Por Poder