

191704

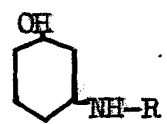
191704

MEMORIA DESCRIPTIVA
 de una Patente de Invención por 20 años,
 a nombre de:
 C I L A G Societé Anonyme, residente en
 Schaffhausen (Suiza), por "PROCEDIMIENTO
 PARA LA OBTENCION DE UN NUEVO ACIDO DI-
 CARBOXILICO".

=====

El objeto de la actual patente es el ácido 4-amino-2-oxi-
 benzol-1,5-dicarboxílico, el cual, como se ha descubierto, pre-
 senta, entre otras propiedades terapéuticamente valiosas, una ex-
 celente actividad contra las bacterias resistentes a los ácidos,
 5 en especial contra los bacilos de la tuberculosis, y por consi-
 guiente ha de emplearse como un fármaco y como un producto inter-
 medio. El invento se refiere además a un procedimiento para la
 preparación de esta nueva combinación, el cual se caracteriza
 porque una combinación de la fórmula general

10



en que R es un átomo de hidrógeno o un radical fácilmente des-
 prendible por hidrolisis, por ejemplo un radical acílico o un ra-
 dical carbalcoxi, y en la que el átomo de hidrógeno existente en
 15 posición p respecto al grupo oxi o al R-NH-, puede sustituirse
 por el grupo carboxilo, o una sal de una combinación de esta cla-
 se, se trata en caliente con ácido carbónico y un carbonato, por
 ejemplo un bicarbonato alcalino o un bicarbonato térreo-alcalino,



de suerte que se forma el ácido 4-amino-2-oxi-benzol-1,5-dicarboxílico. La nueva combinación puede también obtenerse introduciendo grupos formilo en los materiales de partida y oxidando estos grupos formilo en el grupo carboxilo.

Ejemplo 1:

100 g de m-aminofenol, 350 g de agua y 400 g de bicarbonato potásico se calientan en un autoclave a 120° C durante 24 horas con una presión en el ácido carbónico de 15 atmósferas.

Se separa la mezcla de m-aminofenol y bicarbonato potásico precipitado al enfriarse la mezcla de reacción, con ácido nítrico se ajusta la disolución a un pH de 1, se separa por aspiración el ácido 4-amino-2-oxi-benzol-1,5-dicarboxílico precipitado, se lava bien con agua y se reprecipita de la disolución de sosa cáustica con ácido clorhídrico 2 n. El ácido 4-amino-2-oxi-benzol-1,5-dicarboxílico obtenido con buen rendimiento, es un polvo incoloro que funde a 210-211° sin descomponerse. Es fácilmente soluble en álcalis diluidos, moderadamente soluble en metanol, etanol y acetona, prácticamente insoluble en ácidos minerales diluidos y en hidrocarburos.

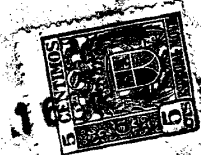
Por neutralización de la disolución de ácido nítrico puede obtenerse como producto secundario y con buena pureza el ácido 4-amino-2-oxi-benzóico originado simultáneamente. La nueva combinación puede también obtenerse sin emplear presión, introduciendo durante largo tiempo CO₂ en una disolución hirviente, con preferencia acuosa, de m-aminofenol y bicarbonato potásico.

Ejemplo 2:

145 g de ácido 4-amino-2-oxi-benzóico, 600 g de bicarbonato potásico y 500 g de agua se calientan en un autoclave a 130° C durante 12 horas con una presión de ácido carbónico de 15 atmósferas. Después de terminada la reacción, se la trata como se ha indicado en el ejemplo 1, obteniéndose con excelente rendimiento el ácido 4-amino-2-oxi-benzol-1,5-dicarboxílico.

191704

= 4 =



racterizado porque se emplea bicarbonato potásico.

4.- Procedimiento según lo reivindicado en el punto 1, caracterizado porque el tratamiento se realiza bajo presión.

Esta patente recae sobre "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN NUEVO ACIDO DICARBOXILICO", como queda descrito en la presente memoria y caracterizado en la anterior Nota.

Madrid, 16 de Febrero de 1.950.

Barcelo