

197676

PATENTE DE INVENCION

CIBA. CASE 2724.

197676



MEMORIA DESCRIPTIVA

sobre:

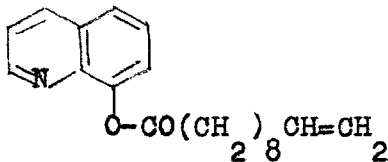
"Procedimiento para la obtención de nuevos ésteres".

=====

SOLICITANTE: C I B A, Soci t  Anonyme,  
domiciliada en Basilea, Suiza.

=====

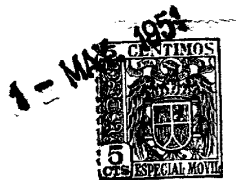
La presente invenci n se refiere a la obtenci n de  steres undecil nicos de 8-oxiquinolinas, especialmente de la 8-oxiquinolina de la f rmula



5. y de hal geno-8-oxi-quinolinas, tal como la 5-cloro-7-yodo-8-quinolina y de sus sales. Estos nuevos  steres son eficaces contra microorganismos, tales como hongos, bacterias y protozoos, y pueden hallar aplicaci n como medicamentos

197676

- 2 -



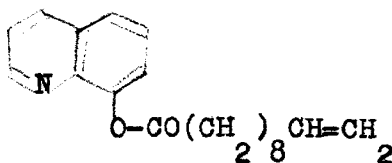
10. contra enfermedades de la sangre causadas por hongos, en primer lugar enfermedades de los piés. Los nuevos compuestos se distinguen ventajosamente del ácido undecilénico y de las 8-oxiquinolinas y sus ésteres conocidos, por ejemplo por su efecto fungicida contra Soor y Tricófito - (tiña). Hay que destacar en particular su eficacia contra zoófitos.
15. Los nuevos ésteres pueden obtenerse según métodos usuales. Así, por ejemplo, puede hacerse reaccionar el ácido undecilénico o sus derivados reactivos, tales como halogenuros o anhídridos, con 8-oxi-quinolinas o sus fenolatos. Esta reacción se realiza con ventaja en presencia de agentes condensadores, especialmente de naturaleza básica, como piridina.
20. Según sea el método de trabajo, se obtienen los nuevos compuestos en forma de sus bases o de sus sales. De las bases libres se pueden obtener las sales en forma usual, como por ejemplo, sales de los ácidos halogenohídricos, ácido sulfúrico, nítrico, fosfórico, sulfocianhídrico, acético, propiónico, oxálico, metanosulfónico, etanosulfónico, oxietanosulfónico, benzolsulfónico o toluolsulfónico.
25. La invención se describe con más detalle en los siguientes Ejemplos. Entre parte en peso y parte volumétrica rige la misma relación existente entre gramo y centímetro cúbico. Las temperaturas se indican en centígrados.
30. EJEMPLO 1.
35. A una solución de 20 partes en peso de 8-oxiquinolina en 100 partes vol. de éter seco y 11'5 partes vol. de piridina, se agrega una solución de 28 partes en peso de cloruro undecilénico en poco éter seco, dejando reposar durante algunas horas. A continuación se trata la mezcla de

1976 76

- 3 -



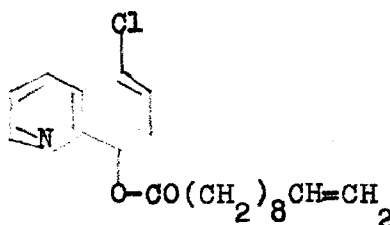
40. reacción a fondo con agua, lejía de sosa cáustica diluida y nuevamente con agua; se seca la solución etérea, se destila el residuo, una vez eliminado el éter, en el alto vacío y se obtiene el éster undecilénico de la 8-oxi-quinolina, de la fórmula



45. en forma de aceite incoloro, siendo el rendimiento de aproximadamente 80%. Punto de ebullición, con una presión de 0'05 mm. a 174-180° C. Adicionando a la solución etérea ácido clorhídrico diluido, se precipita el clorhidrato en forma de precipitado incoloro que funde a 102-104° C.

50. EJEMPLO 2.

20 partes en peso de 5-cloro-8-oxi-quinolina se disuelven en 60 partes vol. de piridina, se agrega una solución de 23 partes en peso de cloruro undecilénico en 100 partes vol. de benzol y se deja reposar durante algunas horas. Elaborando en forma análoga como en el ejemplo 1 destila el éster undecilénico de la 5-cloro-8-oxi-quinolina de la fórmula



60. a una presión de 0'3 mm. a 190-200° C. Punto de fusión a 41-42° C. Rendimiento el 94% de la teoría.

1976

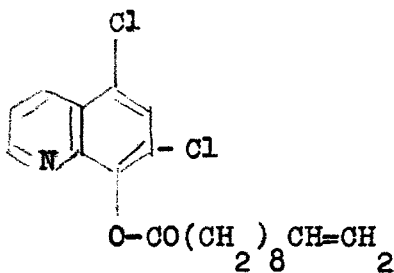
- 4 -



EJEMPLO 3.

65. Se disuelven 9 partes en peso de 5,7-dicloro-8-oxi-quinolina en 100 partes vol. de benzol y 3'5 partes vol. de piridina se agregan 8'6 partes en peso de cloruro undecilénico y se deja reposar durante varias horas. A continuación se trata la mezcla de reacción con agua, ácido clorhídrico diluido y agua, se seca la solución benzólica y, después de eliminar el benzol, se destila el residuo en el vacío. El

70. éster undecilénico de la 5,7-dicloro-8-oxi-quinolina, de la fórmula



75. destila a una presión de 0'15 mm. y a 202-208° C., formando un aceite que se solidifica paulatinamente. Rendimiento 69% teóricos.

EJEMPLO 4.

80. 20 partes en peso de 5-cloro-7-yodo-8-oxi-quinolina se disuelven en 80 partes vol. de piridina, agregándose 13'5 partes en peso de cloruro undecilénico disuelto en 100 partes vol. de éter. Después de prolongado reposo se lava la mezcla de reacción en forma usual, y se seca. Se destila el éter, se disuelve nuevamente el residuo aceitoso en éter, se filtra la solución, agregándose la cantidad calculada

85. de ácido metanosulfónico. El aceite que se separa queda solidificado en el frío. El metanosulfato así obtenido, del éster undecilénico de la 5-cloro-7-yodo-8-oxi-quinolina

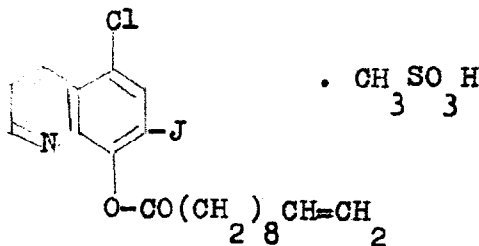
197676

- 5 -



197676

de la fórmula



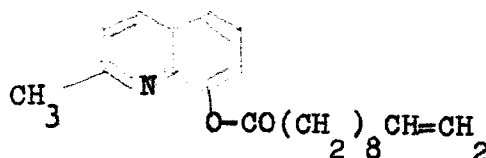
90.

funde a 61-63° C. Rendimiento el 50% de la teoría.

EJEMPLO 5.

A una solución de 20 partes en peso de 8-oxi-quinaldina en 150 partes vol. de éter y 10 partes vol. de piridina, se agrega una solución de 22'5 partes en peso de cloruro undecilénico en 50 partes vol. de éter, dejando reposar durante varias horas. Se lava y se seca la mezcla de reacción en la forma usual. Después de eliminar el éter, destila el éter undecilénico de la 8-oxi-quinaldina, de la fórmula

100.



a una presión de 0'2 mm. y a 194-196° C., con un rendimiento de 78%. En forma análoga puede obtenerse el éster undecilénico de la 5,7-dicloro-8-oxi-quinaldina.

105.

N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no

197676-6-

197676

1 - MAY



110. alteren su principio fundamental. Tambien se hace constar que el invento corresponde a una patente presentada en Suiza con fecha 16 de mayo de 1950, n.º 56536, acogiéndose, por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, y siendo lo que constituye la esencia del

115. referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención, por 20 años en España: "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE NUEVOS ESTERES"; caracterizándose por lo siguiente:

1.º = Procedimiento para la obtención de nuevos ésteres, caracterizado porque se obtienen ésteres undecilénicos de 8-oxi-quinolinas.

2.º = Procedimiento según reivindicación 1.º, caracterizado porque se obtiene el éster undecilénico de la 8-oxi-quinolina.

125. 3.º = Procedimiento, según reivindicación 1.º, caracterizado porque se obtiene el éster undecilénico de la 5-cloro-7-yodo-8-oxi-quinolina.

4.º = Procedimiento para la obtención de nuevos ésteres; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria, que consta de seis hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 1 - MAY. 1951

CIBA, Société Anonyme.

P.P. de J. GOMEZ ACEBO y MODET