



325348

- 9 APTM - 1950

325348

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

=====

por VEINTE años

cuyo privilegio se solicita para España,
sus territorios y plazas de soberanía,
a favor de :

LISAC, S.A.

entidad española, domiciliada en San Faus
to de Campcentelles (Barcelona), calle
Rosario, s/n. relativa a :

"PROCESO DE OBTENCION DE SULFONATOS DE
2,4-DIAMINO 5-p CLOROFENIL 6-ETILPIRIMIDI
NA".

=====

Inventor: Antonio L. Palomo Coll

- 9 ABR



325348

MEMORIA DESCRIPTIVA

En la presente invención se describe un proceso de preparación de nuevos compuestos derivados de la 2,4 diamino-5- p clorofenil-6-etilpirimidina, los cuales presentando las mismas propiedades antimaláricas, se intensifica la acción coccidios-
 5. tática. - - - - -

Otra importante propiedad que muestran las nuevas substancias, viene determinada por la posibilidad de obtener preparados solubles en medios acuosos de dimetilformamida y polietilenglicoles o bien seleccionar los compuestos de mayor insolubilidad en agua para su utilización como aditivo en piensos, con cargas inertes y ya sean mezclados con otros coccidiostáticos conocidos como la sulfoquinoxalina, nitrofuranos y antibióticos tales como la bacitracina, etc. - - - - -

15. Sabido es que los ácidos sulfónicos con las aminas forman en general sales muy solubles en agua, excepción de las aminas aromáticas. Han sido halladas substancias con grupos aminos no substituídos en anillos aromáticos que presentan gran insolubilidad y estabilidad, descritos en la patente española nº
 20. 314924, incluyendo ahora los sulfonatos de la 2,4-diamino-5- p clorofenil-6-etilpirimidina con las propiedades anteriormente mencionadas. - - - - -

- 9 APR



325348

Para el objeto de la presente invención, se hace reaccionar un ácido sulfónico aromático o sus sales alcalinas en presencia de ácido sulfúrico con la 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina. - - - - -

5. Medios adecuados para realizar la combinación química anterior, son los sistemas de disolventes constituidos por mezclas isopropanol-agua, dimetilformamida-agua, isopropanol-dimetilformamida y otros análogos. - - - - -

10. Las temperaturas para efectuar la operación de transformación, varían desde la ambiente hasta ebullición del disolvente. - - - - -

15. El aislamiento del producto formado es conseguido por simple enfriamiento de la solución o bien diluyendo con suficiente agua, si bien en la mayoría de los casos se inicia en caliente la precipitación, en forma cristalina, de los preparados de acuerdo a su concentración. - - - - -

Los productos aislados, basta su lavado con agua para obtenerlos en estado de elevada pureza. - - - - -

20. En general la operación puede ser ejecutada con el utillaje normal de la industria, sin necesidad de más especificaciones para su ejecución. - - - - -

Todas estas substancias dan ensayo positivo de azufre y la banda de absorción correspondiente a los sulfonatos en el I.R. - - - - -



9 AB

325348

EJEMPLO I

5. A 500 partes de isopropanol 50% se adicionan 40 partes de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina y 40 partes de ácido p-toluensulfónico. Se calienta a reflujo hasta disolución completa. Se enfría y filtra, lava con agua obteniendo con rendimiento prácticamente cuantitativo el p-toluensulfonato de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, cristales blancos con F = 281-4°C. - - - - -

EJEMPLO II

10. A 500 partes de isopropanol 60% se adicionan 40 partes de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, 40 partes de 4-cloro-3-nitro-bencenosulfonato sódico y 16 partes de ácido sulfúrico concentrado; se calienta a disolución, enfría, filtra y lava con agua, obteniendo con rendimiento casi cuantitativo el 4-cloro-3-nitro-bencenosulfonato de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, cristales ligeramente amarillos y F = 280-2°C.

Con el mismo procedimiento se obtiene el 4-clorobencenosulfonato, escamitas blancas y F = 279-282°C. - - - - -

EJEMPLO III

20. En 30 partes de dimetilformamida se disuelven 20,8 partes de ácido 8-oxiquinolin-5-sulfónico y 24,8 partes de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, calentando hasta disolución. Se adicionan 60 partes de agua y deja cristalizar. Se obtienen 41 partes del correspondiente 8-oxiquinolin-5-sulfonato con rendimiento del 90%, agujitas blanco ligeramente amarillas y F = 224-4°C. - - - - -



325348

Con ácido 7-nitro-8-oxiquinolin-5-sulfónico utilizando el mismo procedimiento, es obtenido el sulfonato, polvo microcristalino de color amarillo calabaza y F = 262-820 (d). - - -

5. Habiendo descrito suficientemente las características de la invención, debe hacerse constar, en resumen, que en la misma podrá introducirse cuantas variantes de detalle la experiencia y la práctica puedan aconsejar, siempre que no afecten a su esencialidad, que es la que se concreta en las reivindicaciones que siguen. - - - - -

10.

N O T A

Se declaran de novedad y propiedad para España, sus territorios y plazas de soberanía, las siguientes: - - - - -

R E I V I N D I C A C I O N E S

15. 1.- Proceso de obtención de sulfonatos de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, caracterizado por hacer reaccionar ácidos sulfónicos con 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina en disolventes. - - - - -

20. 2.- Proceso de obtención de sulfonatos de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, según la anterior reivindicación, caracterizado por utilizar como disolventes la dimetilformamida, isopropanol, sus mezclas y juntamente con agua. - -

3.- Proceso de obtención de sulfonatos de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, según las anteriores reivindicaciones, caracterizado por calentar desde temperatura am-

325348

9 ABR



biente a la de ebullición de los disolventes. - - - - -

4.- Proceso de obtención de sulfonatos de 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina, según las anteriores reivindicaciones, caracterizado por utilizar ácidos sulfónicos aromáticos y de anillos condensados, con 2,4-diamino-5-p clorofenil-6-etilpirimidina para obtener sulfonatos. - - - - -

5.- "PROCESO DE OBTENCION DE SULFONATOS DE 2,4-DIAMINO-5-p CLOROFENIL-6-ETILPIRIMIDINA". - - - - -

10. Todo ello conforme se describe y reivindica en la presente memoria que consta de seis hojas, foliadas y mecanografiadas por una sola de sus caras.

9 ABR 1966

Carbonell

Por Poder
Firmado: J. Carbonell

ad.