



1966

328896

328896

PATENTE DE INVENCION

por 20 años

por "UN METODO PARA LA PRODUCCION DE UN NUEVO ESTER DEL ACIDO PIRIDINCARBOXILICO", a favor de AKTIEBOLAGET BOFORS, de nacionalidad sueca, domiciliada en BOFORS (Suecia).

=====

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un método para producir un ester entre el ácido pirindin -2,5- dicarboxílico o derivados del mismo y el B-piridil carbinol o sus derivados.

El ester en cuestión está destinado a ser utilizado

- 5. como producto farmacéutico para composiciones que tengan un efecto de dilatación de vasos interior o exteriormente, en los casos en que sea de gran importancia la solubilidad en el agua.

El nuevo ester en cuestión se caracteriza por su capacidad, en la hidrólisis, de formar dos moléculas de β -piri-

- 10. dil carbinol y una molécula de ácido piridin -2,5- dicarboxílico, que con una descarboxilación-2, da una molécula de ácido ni cotínico.

El nuevo ester se caracteriza por tener un efecto di-

- 15. latador de vasos que es suave pero de larga duración y que es de importancia en la práctica medicinal, particularmente para el grupo de pacientes que experimentan fuertes efectos secundarios



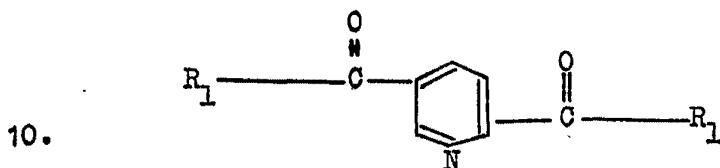
25 JUN 1966

0200

328896

producidos por otros agentes dilatadores de vasos. El nuevo ester se produce por métodos ordinarios que en sí mismos son conocidos, pero de un modo más apropiado sin embargo, por una reacción entre el dicloruro del ácido isocincomerónico y el β -piridil carbinol.

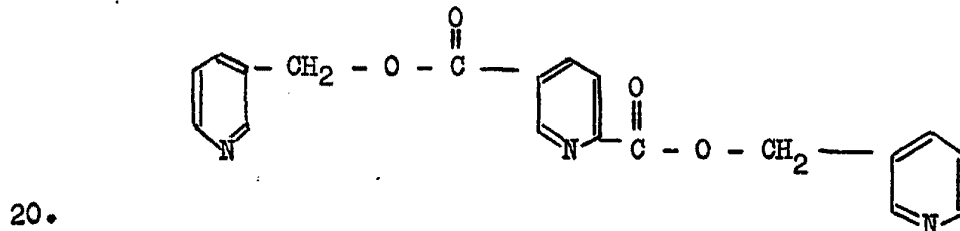
El método de producción es en general, permitir la obtención de un compuesto de piridina de la siguiente fórmula:



para reaccionar con un segundo compuesto de piridina de la siguiente fórmula:



mientras se forma un ester con la fórmula:



en el cual R_1 puede ser o bien un grupo OH, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo OR_2 , en el cual R_2 consiste en un átomo de metal, por ejemplo sodio o potasio. R_3 puede ser un grupo OH, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo OR_2 , en el cual R_2 tiene el mismo significado que el descrito anteriormente.

La invención se describirá con más detalle en el ejemplo siguiente.

Ejemplo:

30. En un aparato de reacción de 1.000 ml., se mezclan 98 gr. de β -piridil carbinol con 86 gr. de trietil amina y 300 gr.



1966

328896

de benceno, agitando, después de lo cual se arrojan 90 gr. de cloruro de ácido isocincomerónico disuelto en 100 gr. de benceno, agitando continuamente y enfriando. La agitación se continua todavía 24 horas a la temperatura ambiente. La precipi-

5. tación así formada se separa por filtrado y se lava con agua para eliminar el cloruro de trietil amina. La masa cristalina restante se disuelve en 700 gr. de alcohol etílico hirviendo, seguido de un tratamiento con carbón activo y filtrado. Con un enfriamiento lento, cristalizan 95 gr. (67%) de piridin -2,5-

10. ácido dicarboxílico-di (B-piridil carbinol ester). El punto de fusión es 142-143°C.

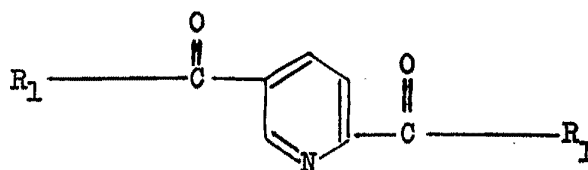
Todo cuanto no afecte, altere, cambie o modifique la esencia del método descrito, será variable a los efectos de la actual Patente.

15. N O T A.

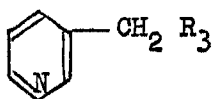
Se reivindica como objeto de esta Patente de invención:

1.- Un método para la producción de un nuevo ester del ácido piridincarboxílico, caracterizado porque un compuesto de

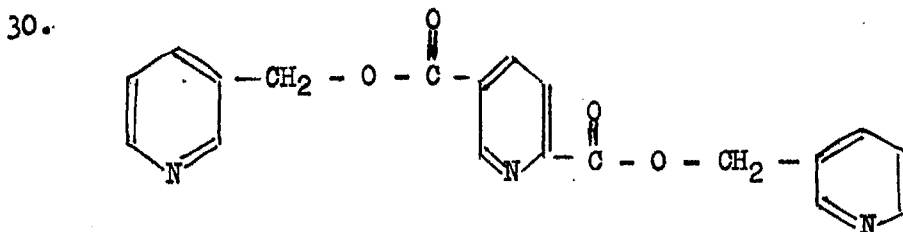
20. la piridina de la fórmula desarrollada:



25. se hace reaccionar con un segundo compuesto de piridina con la fórmula:



mientras se forma un ester con la fórmula:





JUN 1966

328896

- 4 -

en el cual R_1 puede ser o bien un grupo OH, un átomo de cloro, o de bromo o un grupo OR_2 en el cual R_2 consiste de un átomo de metal, por ejemplo sodio o potasio y en el cual R_3 puede ser un grupo OH, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un

5. grupo OR_2 , siendo entonces posible desde luego, que el ester obtenido pueda convertirse de un modo conocido en una sal compatible con los tejidos, por ejemplo un cloruro.

2.- El propio método según la reivindicación 1, caracterizado por utilizarse particularmente un disolvente inerte.

10. 3.- El propio método de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizado por utilizarse una amina terciaria como medio de absorber hidrógeno alógeno cuando R_1 es un átomo de cloro o un átomo de bromo.

15. Sean cuales fueren las circunstancias que concurren en la esencialidad de la Patente de invención, definida en las anteriores reivindicaciones, cuyo objeto es:

4.- "UN METODO PARA LA PRODUCCION DE UN NUEVO ESTER DEL ACIDO PIRIDINCARBOXILICO".

20. Consta la presente memoria de cuatro hojas foliadas, mecanografiadas por una sola cara.

Barcelona, 25 JUN 1966

P.A. de AKTIEBOLAGET BOFORS,