

OG. 20.918.-MI

386324



386324

PATENTE DE INVENCION

INDICACION	e.07
SUBCLASE	D

MEMORIA DESCRIPTIVA

Sobre:

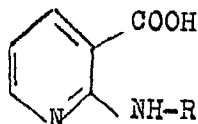
" PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE ACIDOS 2-ANILINNICOTINICOS "

Solicitante: La entidad española: LABORATORIOS LANDERLAN, S.A.  
domiciliada en Madrid, calle Agastía nº 67.

Inventor: Don José ACOSTA MIRA.

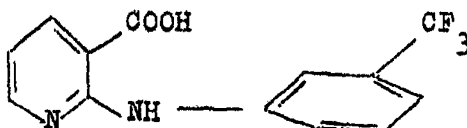


Mediante la presente invención se desarrolla un procedimiento de preparación de ácidos 2-anilinnicotínicos y derivados representados por la fórmula siguiente:



5. donde R es un anillo aromático con o sin uno o más sustituyentes del tipo alquilo, haloalquilo, metoxilo, halógeno, hidróxilo, etc.

En el proceso de la presente invención se hace reaccionar el ácido 2-cloronicotínico con la amina correspondiente, y se ha demostrado que es especialmente adecuado para preparar el compuesto de fórmula



a partir del ácido 2-cloronicotínico y m-trifluorometilnilina.

15. La reacción se consigue en ausencia de catalizadores, calentando el ácido halogennicotínico con un exceso de la amina correspondiente que hace a la vez de disolvente de reacción. Otra característica fundamental del proceso consiste en que el producto final se aísla directamente en forma cristalina y con muy alto grado de pureza, lo que hace innecesaria una cristalización o purificación posterior.

20. Los productos obtenidos pueden usarse, bien directamente o bien en forma de sus sales con iones metálicos, alcalino, alcalino-térreos o con aluminio, siendo éste muy adecuado.

25.

20673

- 3 -

38632410



Ejemplo 1.- Acido 2 (m-trifluorometil anilin) nicotínico.

5. 5 partes de ácido 2 cloronicotínico y 20 a 30 volúmenes de m-trifluorometilanilina se mezclan y calientan a 120°C. Se produce una reacción exotérmica que eleva la temperatura unos 15 - 20°C. y que se completa en 10 minutos. Durante este tiempo es necesaria una agitación efectiva de la masa.

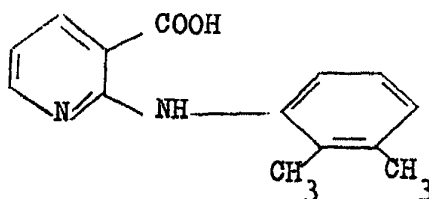
10. Esta masa aún caliente (80 - 100°C) se vuelve cuidadosamente con agitación sobre una mezcla de alcohol y ácido clorhídrico diluido (1:1) suficiente para neutralizar el exceso de amina y se continúa la agitación por 2 horas más a 0-5°C. El sólido que cristaliza se separa por filtración, se lava con un poco de mezcla hidroalcohólica y con agua.

15. Seco se muestra como un polvo amarillo, cristalizado en pequeñas agujas, de p. f. 204 - 6°. y cuyas características de espectro infrarrojo, análisis de N Kjehldal (encontrado 9,8%, calculado 9,93%) y valoración con perclórico demuestran que es ácido 2(m-trifluoro metilanilina) nicotínico. Se obtienen de 7 a 8 partes.

20. En el líquido filtrado se puede recuperar la amina excedente mediante adición de alcalí y extracción con un disolvente orgánico inmiscible con agua como benceno, cloroforno, cloruro de metileno, etc.

Ejemplo 2.- Acido 2-(2,3 xilidin) nicotínico.

25. Se opera como en el ejemplo anterior sustituyendo la m-trifluorometil anilina por 2,3 xilidina



2673

- 4 -

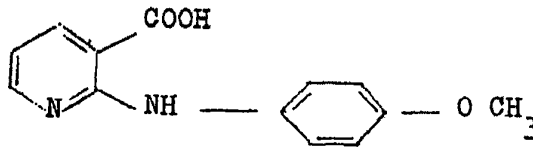
386324



El producto así obtenido presenta un punto de fusión de 246-82C, N calculado 11,56 encontrado 11,42, y espectro infrarrojo de acuerdo a la fórmula indicada.

Ejemplo 3.- Acido 2 (p-anixidin)nicotínico.

5. En el ejemplo 1 se sustituye la m-trifluorometil-anilina por p-anixidina. El producto final tiene p. f. 205-72C.



Ejemplo 4.- Se usan las siguientes aminas en sustitución de la m-trifluorometilanilina en el ejemplo 1: anilina, toluidinas, 2,6 xilidina, y 2 metil 4 cloroanilina.

10.

La entidad solicitante se reserva el derecho de extender esta demanda a los países extranjeros, reivindicando la misma prioridad de la presente solicitud al amparo del Convenio Internacional para la protección de la Propiedad

15.

Industrial.

Igualmente la solicitante se reserva el derecho de introducir en la presente invención cuantos perfeccionamientos sobre la misma puedan derivarse, mediante la solicitud de los correspondientes Certificados de Adición en la forma señalada por la Ley.

20.

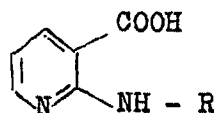
N O T A

La Patente de Invención, que se solicita por veinte años, para España, de acuerdo con la vigente Legislación, deberá recaer sobre: "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE ACIDOS 2-ANILINNICOTINICOS", según las características esenciales de las siguientes:

25.

REIVINDICACIONES

1ª.- Procedimiento de preparacion de ácidos 2-anilinnicotínicos, correspondientes a la fórmula general:



5. en la cual R es un anillo bencénico o aromático sustituido con radicales metilo, metilos, metoxilos, trifluorometil o halógeno en diversas posiciones y caracterizado porque se hace reaccionar sin catalizador el ácido 2 cloro-nicotínico con la amina aromática correspondiente, cuya amina hace a su vez de disolvente de la reacción, obteniéndose directamente el producto en forma cristalina y pudiéndose recuperar parcialmente el exceso de la amina empleada como disolvente.
- 10.

- 2ª.- Procedimiento de preparación de ácidos 2-anilinnicotínicos, según reivindicación 1ª y caracterizado porque la amina puede ser la m-trifluorometilanilina, 2,3 xilidina, p-metoxianilina, anilina, toluidinas, y 2 metil 4 cloroanilina.
- 15.

- 3ª.- PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE ACIDOS 2-ANILINNICOTINICOS.
- 20.

Según queda sustancialmente descrito en la presen-

.../...

206-73

- 6 -

386324

4001



te memoria, que consta de seis hojas, escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 10 de Diciembre de 1970

LABORATORIOS LANDERLAN, S. A.  
P. P.

FRANCISCO GARCIA CARRERIZO  
P. P.

Firmado: M.<sup>a</sup> Dolores Jorquera