



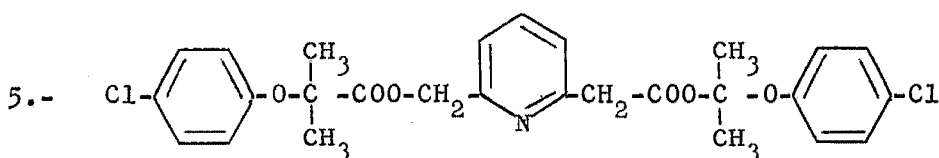
ESPAÑA

19 ES	11 NUMERO	10 AT
	21	
	22 FECHA DE PRESENTACION	

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
---	---	---
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07C, A61K	---
54 TITULO DE LA INVENCION		
"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO FARMACO CON ACCION HIPOCOLESTEREMIANTE"		
71 SOLICITANTE (S)		
La Entidad española: ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVER- SALES, S.A. (E.L.M.U. S.A.)		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
MADRID C/Emilio Vargas, nº 2		
72 INVENTOR (ES)		
Don Fernando MONTORO Don Antonio VILA-CORO Don José CALATAYUD		
73 TITULAR (ES)		
ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVERSALES, S.A. (ELMU, S.A.)		
74 REPRESENTANTE		
---		

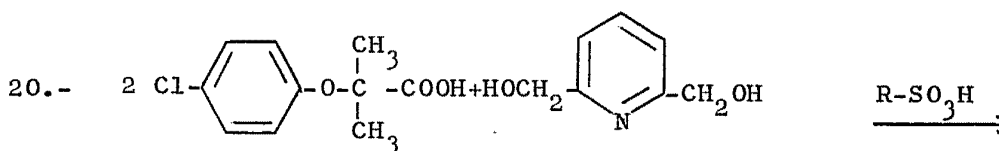
Esta invención tiene por objeto la obtención del éster bis-2-(p-cloro-fenoxi-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol, cuya fórmula estructural es la siguiente:



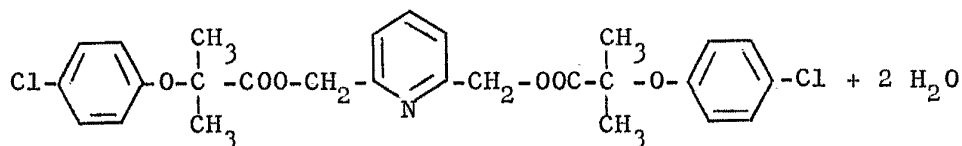
#### DESCRIPCION DEL PROCESO

Para obtener el bis-2-(p-cloro-fenoxi-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol, se parte del ácido 2-(p-cloro-fenoxi-isobutírico) y de 2,6  
 10.- piridín-dimetanol, que en presencia de un catalizador ácido, preferiblemente ácidos sulfónicos, o bien, ácido sulfúrico, se esterifican. El método empleado elimina continuamente el agua formada durante la esterificación, desplazando  
 15.- así, el equilibrio de la reacción hacia la formación del éster y aumentando en mucho el rendimiento de la reacción.

La reacción que tiene lugar es la siguiente:



.../...



La invención será descrita en los ejemplos que siguen, sin que los mismos deban ser considerados como una limitación del objeto de la invención.

5.-

#### EJEMPLO I

Síntesis de bis-2-(p-cloro-fenoxy-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol clorhidrato.

42,8 gr (0,2 mol) de ácido p-cloro-fenoxy-isobutírico son disueltos en 200 cc de xileno seco. Se añaden 2,6 gr de ácido p-tolueno-sulfónico a esta disolución y 13,98 gr (0,1 mol) de 2,6 -piridín-dimetanol. La mezcla se calienta a reflujo entre 100-110°C en un matraz de tres bocas, provisto de agitador, refrigerante de reflujo y un embudo separador de agua, eliminando ésta de la reacción, hasta que no se forme más  $\text{H}_2\text{O}$ . La disolución se vierte sobre otra, saturada de carbonato potásico. La fase orgánica es lavada con tres porciones de 50cc de agua, se seca con carbonato potásico anhidro y se elimina el xileno en un evaporador rotativo. El residuo se disuelve en etanol absoluto y se pasa a la disolución alcohólica, corriente de cloruro de hidrógeno seco. El pro-

10.-

15.-

20.-

25.-

../...

ducto precipita por la adición de éter etílico y se recristaliza en etanol/éter.

Rendimiento: 45 gr

Rendimientos similares se obtienen, empleando como catalizadores ácido sulfúrico, ácido timolsulfónico u otros ácidos sulfónicos.

ANALISIS ELEMENTAL

CALCULADO				ENCONTRADO			
%C	%H	%N	%Cl	%C	%H	%N	%Cl
55,50	4,44	2,59	19,70	55,43	4,51	2,54	19,72

Punto de fusión: 120-122°C

10.- ESPECTRO INFRARROJO: Ver figura 1.

En la hoja del plano, que acompaña a la presente memoria, se ha representado el espectro infrarrojo de este compuesto, según la relación de figura y compuesto.

15.- Figura 1: Espectro infrarrojo de bis-2(p-clorofenoxi-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol clorhidrato.

NOTA

La Patente de Invención, que se solicita por veinte años, de acuerdo con la vigente legisla-

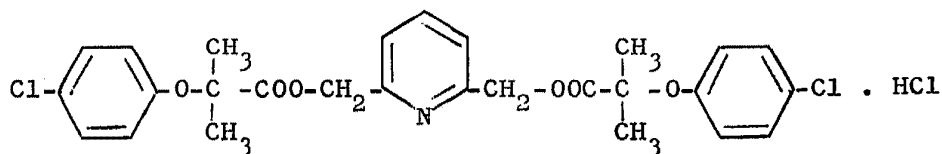
ción, deberá recaer sobre:

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO FARMACO CON ACCION HIPOCOLESTEREMIANTE", según las características de las siguientes

5.-

REIVINDICACIONES

1ª.-PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO FARMACO CON ACCION HIPOCOLESTEREMIANTE, que responde a la estructura siguiente:



10.- cuyo procedimiento está caracterizado, porque se hace reaccionar doble cantidad molar de ácido p-cloro-fenoxi-isobutírico con 2,6-piridín-dimetanol, en presencia de un catalizador ácido.

2ª.-PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO FARMACO CON ACCION HIPOCOLESTEREMIANTE; según reivindicación anterior, caracterizado porque el catalizador ácido empleado es, preferentemente, un ácido sulfónico aromático, concretamente los ácidos p-tolueno, sulfónico y el timol-sulfónico, aunque también puede emplearse el ácido sulfúrico, y, porque el medio de reacción ha de ser inmisible con el agua, preferentemente xileno o tolueno.

.../...

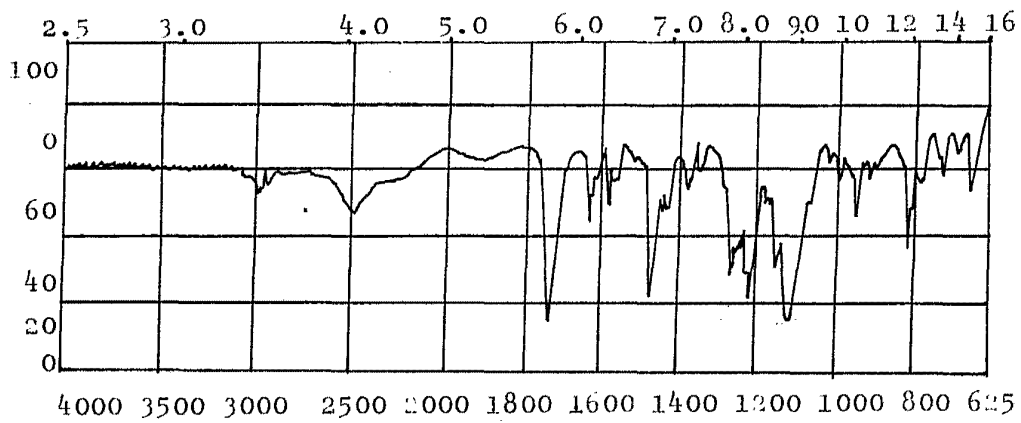
3a.-PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN NUEVO FARMACO CON ACCION HIPOCOLESTEREMIANTE, según queda sustancialmente descrito en la presente memoria, que consta de cinco hojas escritas a máquina por una sola cara y dibujo.

Madrid, 15 OCT. 1974

Especialidades Laborales Medicamentos Universales  
"ELMU", S. A.

  
Consejero-Delegado





MADRID, 15 OCT. 1974

Especialidades Latinas-Medicamentos Universales  
"E.L.M.U.", S. A.

*[Signature]*  
Consejero-Delegado