



(19) ES	(11) NUMERO	(10) A1
	(21) 447.362	
	(22) FECHA DE PRESENTACION	

447.362

PATENTE DE INVENCION

(30) PRIORIDADES:	(32) FECHA	(33) PAIS
(31) NUMERO		
---	---	---

(47) FECHA DE PUBLICIDAD	(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL	(52) PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07D/A61K	---

(54) TITULO DE LA INVENCION

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLORO-FENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL".

(71) SOLICITANTE (S)

La Entidad Española: ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVERSALES, S.A. (ELMU, S.A.)

DOMICILIO DEL SOLICITANTE

MADRID C/Emilio Vargas, nº 2

(72) INVENTOR (ES)

Don Fernando MONTORO
Don José CALATAYUD
Don Angel VILAR

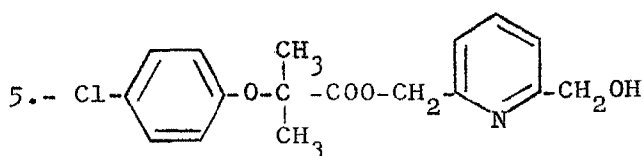
(73) TITULAR (ES)

ESPECIALIDADES LATINAS MEDICAMENTOS UNIVERSALES, S.A.
(ELMU, S.A.)

(74) REPRESENTANTE



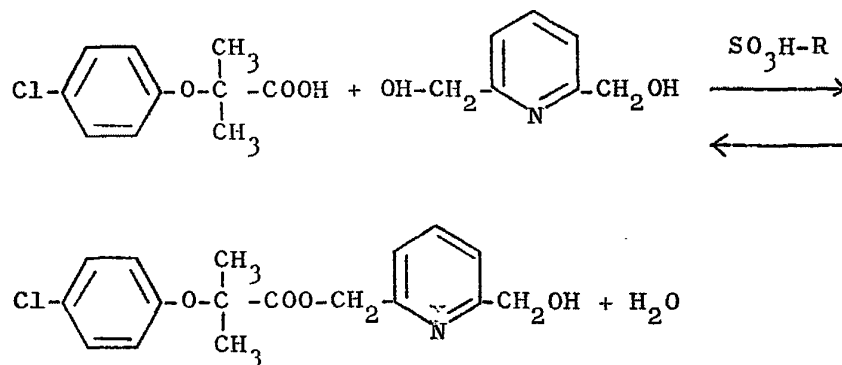
Esta invención tiene por objeto la obtención del éster 2-(p-cloro-fenoxi-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol, que responde a la siguiente fórmula estructural:



DESCRIPCION DEL PROCESO

Para obtener el 2-(p-cloro-fenoxi-isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol, se parte del ácido 2-(p-cloro-fenoxi-isobutírico) y de 2,6-piridín-dimetanol, que, 10.- en presencia de un catalizador ácido, preferentemente ácidos sulfónicos, o bien, ácido sulfúrico, se esterifican.

La reacción se verifica del modo siguiente:



15.- En un segundo paso se forma el clorhidrato, o

.. / ...



bien otras sales, ya sean de ácido orgánico o inorgánico terapéuticamente utilizable.

La invención será descrita en el ejemplo que sigue, sin que el mismo deba ser considerado como una limitación del objeto de la invención.

EJEMPLO I

Síntesis de 2-(p-cloro-fenoxi isobutirato) de 2,6-piridín-dimetanol.

- 128,76 gr (6 mol) de ácido p-cloro-fenoxi-isobutírico
- 10.- se disuelven en 900 ml de tolueno seco. Se añaden 2ml de SO_4H_2 concentrado a esta disolución y 84 gr (6 mol) de 2,6-piridín-dimetanol. La mezcla se calienta a reflujo entre 106-111°C en un matraz de tres bocas, provisto de agitador, refrigerante de reflujo y embudo
- 15.- separador de agua, eliminando ésta de la reacción, hasta que no separe más agua. La disolución se vierte sobre otra saturada de CO_3K_2 . La fase orgánica se lava tres veces, con porciones de 250 ml de agua, se seca con carbonato potásico anhidro y se elimina el
- 20.- tolueno en un evaporador rotativo. El residuo se disuelve en etanol absoluto, pasándose a la disolución alcohólica corriente de cloruro de hidrógeno seco. El producto precipita por la adición de éter etílico y se recristaliza en acetato de etilo. Rendimiento 56%.
- 25.- Rendimientos similares se obtienen empleando como catalizadores ácido timol sulfónico u otros ácidos sulfónicos.

../...



ANALISIS ELEMENTAL

CALCULADO

%C	%H	%N	%Cl
54,83	5,15	3,76	19,06

ENCONTRADO

%C	%H	%N	%Cl
54,85	5,12	3,8	19,03

Punto de fusión: 126°C

ESPECTRO INFRARROJO: Ver figura I.

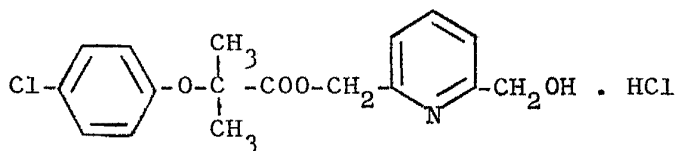
5.- NOTA

La Patente de Invención que se solicita por veinte años, de acuerdo con la vigente legislación, deberá recaer sobre:

"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLORO-10.- FENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL", según las características de las siguientes

REIVINDICACIONES

1ª.-PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLO-ROFENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL, que 15.- responde a la estructura siguiente:



cuyo procedimiento está caracterizado, porque se ha- ce reaccionar, mol a mol, el ácido p-cloro-fenoxi- isobutírico con 2,6-piridín-dimetanol, en presencia 20.- de un catalizador ácido.

20



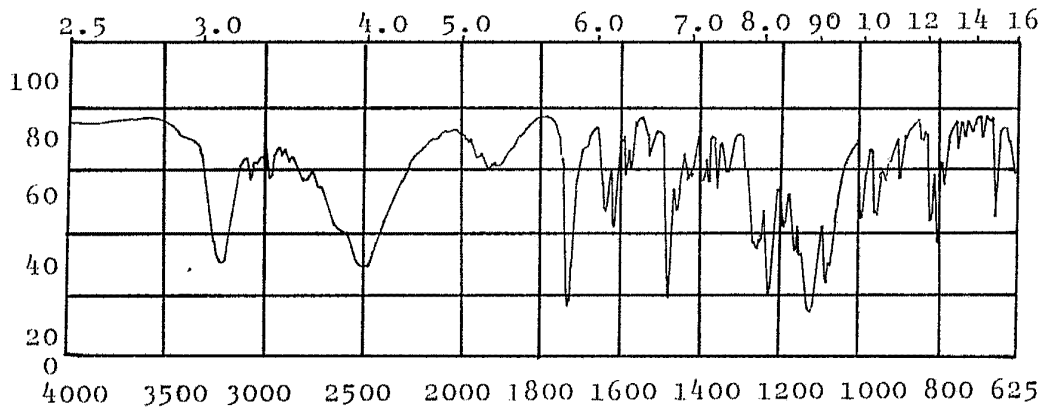
- 2ª.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLO-ROFENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL, según reivindicación anterior, caracterizado porque el catalizador ácido empleado es un ácido sulfónico aromático,
- 5.- concretamente los ácidos p-toluen-sulfónico, timol-sulfónico y ácido sulfúrico y, porque el medio de reacción ha de ser inmiscible con el agua, preferentemente xileno o tolueno.
- 3ª.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLO-ROFENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque a partir de él, pueden realizarse diversas sales de ácido orgánico o inorgánico, que puedan utilizarse en terapéutica.
- 10.-
- 4ª.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLO-ROFENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL, según reivindicaciones anteriores, caracterizado porque el método de esterificación seguido es el del "azeótropo", que elimina continuamente el agua formada durante la esterificación.
- 15.-
- 5ª.- PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DEL MONOESTER 2-(p-CLO-ROFENOXI-ISOBUTIRATO) DE 2,6-PIRIDIN-DIMETANOL, según queda sustancialmente descrito en la presente memoria, que consta de cuatro hojas escritas a máquina por una sola cara y dibujos.
- 20.-
- 25.-

pe

Madrid, 27 ABR. 1976

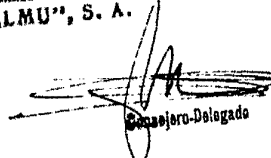
Especialidades Lácteos-Edulcorantes Enterales
"ELMU", S. A.

[Handwritten signature]
Consejero-Delegado



MADRID, 27 ABR. 1976

Especialidades Látiex-Medicamentos Universales
"ELMU", S. A.



Consejero-Delegado

ESCALA VARIABLE