

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y ENERGIA  
Registro de la Propiedad Industrial



ES	(11) NUMERO 465.489	(10) A1
	(21) FECHA DE PRESENTACION 28 DIC. 1977	

5 DIC. 1978

Concedido el Registro de acuerdo  
con los datos que figuran en la pre-  
scripción y según el con-  
tenido de la Memoria adjunta.

**PATENTE DE INVENCION**

(30) PRIORIDADES:	(32) FECHA	(33) PAIS
(31) NUMERO 2251/CI-1708/1976	30 diciembre 1976	Hungría

(47) FECHA DE PUBLICIDAD	(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL C07C	(62) PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA ---
--------------------------	--	---

(54) TITULO DE LA INVENCION "Procedimiento para la preparación de 2-aminobencimidazol"
---

(71) SOLICITANTE (ES) CHINOIN GYÓGYSZER ÉS VEGYÉSZETI TERMÉKEK GYÁRA R.T.
--

DOMICILIO DEL SOLICITANTE Tó u. 5, Budapest - Újpest 1, Hungría
--

(72) INVENTOR (ES) Géza Tóth
---------------------------------

(73) TITULAR (ES)
-------------------

(74) REPRESENTANTE M. Currell Sufiol
---

20523-77 - AG/Cej  
EX-HU-II

POOR  
QUALITY

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

por VEINTE años

5. solicitada en España a favor de CHINÓIN GYÓGYSZER ÉS  
VEGYÉSZETI TERMÉKEK GYÁRA R.T., de nacionalidad húngara,  
domiciliada en Té u. 5, Budapest - Újpest 1, Hungría,  
por "Procedimiento para la preparación de 2-aminobenci-  
midazol", con prioridad de la solicitud húngara 2251/CI-  
1708/1976 de fecha 30 Diciembre 1976. - - - - -

MEMORIA DESCRIPTIVA

10. Esta invención proporciona un nuevo procedi-  
miento para la preparación de 2-aminobencimidazol. - -

15. El 2-aminobencimidazol es un importante inter-  
medio en la síntesis química de varios compuestos orgáni-  
cos que tienen actividad biológica. Estos compuestos pue-  
den tener, por ejemplo, una fuerte influencia en el sis-  
tema nervioso central o pueden utilizarse como antihel-  
mínticos. - - - - -

20. Existen varios métodos conocidos en la técnica  
para la preparación de 2-aminobencimidazol. La adaptabili-  
dad práctica de estos métodos a la producción industrial

es, sin embargo, mala. - - - - -

5. Se ha hallado ahora que puede prepararse también 2-aminobencimidazol, a gran escala, por ebullición de 2-metoxicarbonilaminobencimidazol con una disolución concentrada de bromuro de hidrógeno durante varias horas. - - - - -

10. El procedimiento se realiza preferentemente por adición de 2-metoxicarbonilbencimidazol a la disolución acuosa de bromuro de hidrógeno, elevando la temperatura hasta 80-90°C, cuidadosamente y bajo agitación, y manteniendo la mezcla de reacción a esta temperatura hasta que disminuye el desprendimiento de gases. Entonces la mezcla de reacción se calienta hasta unos 115-125°C, bajo agitación. La temperatura final que puede alcanzarse es función de la concentración de la disolución de bromuro de hidrógeno utilizada. La mezcla se agita a la misma temperatura durante aproximadamente 3 horas, se enfría a 60°C, se diluye con agua y se alcaliniza con una disolución acuosa de hidróxido sódico. El producto desecado precipita al agitar a temperatura ambiente. El 2-aminobencimidazol obtenido puede purificarse ventajosamente por recristalización a partir de agua utilizando carbón vegetal como decolorante. - - - - -

15.

20.

La invención se ilustra por medio del siguiente ejemplo no limitativo. - - - - -

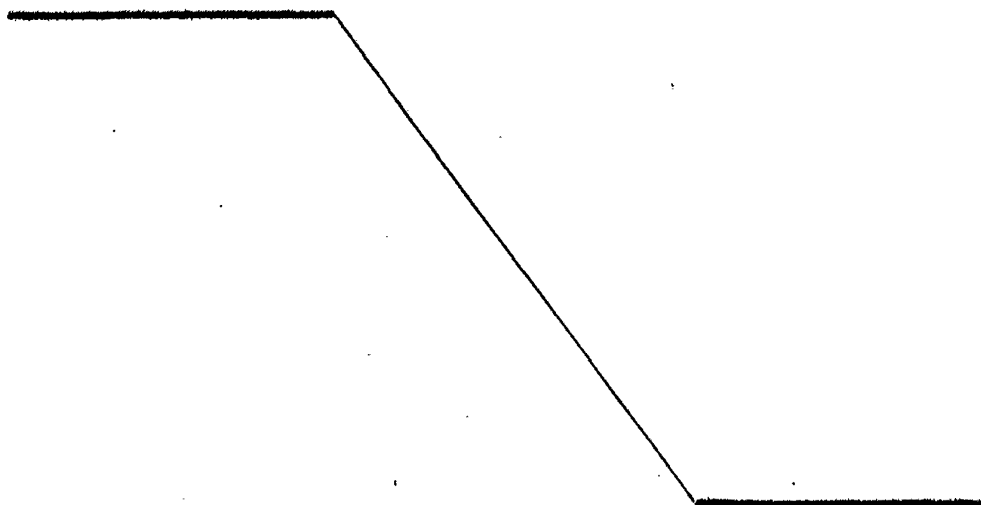
Ejemplo

Se pesan 168 g de disolución acuosa de bromuro de hidrógeno y se introducen en un matraz provisto de un condensador de reflujo, de un agitador y de un embudo de goteo, junto con 42 g de 2-metoxicarbonilaminobencimidazol. La concentración de la disolución de bromuro de hidrógeno es de unos 50 a 52%. Se inicia la agitación y la temperatura se eleva cuidadosamente hasta 80-90°C. Puede observarse un fuerte desprendimiento de gases. La mezcla de reacción se agita a esta temperatura hasta que disminuye el desprendimiento de gases. Entonces se calienta hasta unos 115-125°C y se agita a esta temperatura durante, aproximadamente, las 3 horas siguientes. La reacción está acabada cuando cesa el desprendimiento de gases. La mezcla de reacción se enfría a 60°C, se añaden 84 ml de agua y se enfría a temperatura ambiente. Se disuelven 32,9 g de hidróxido sódico puro en 33 g de agua y se ajusta el valor de pH de la anterior mezcla de reacción hasta 9, por adición de la última disolución bajo refrigeración, con agitación continua. Debe tenerse cuidado en que la temperatura de la mezcla de reacción no sobrepase la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agita a esta temperatura durante las siguientes 6-8 horas. Entre tanto, se controla el valor de pH de la disolución y se reajusta a pH 9, si es necesario. Si la disolución de hidróxido sódico se consume antes de que empiece la precipitación del producto, se añade a la mezcla de reacción otra porción (aproximadamente 50%) de disolución de hidróxido sódico. - - - - -

Después de 6-8 horas de agitación el producto precipitado se separa por filtración. El peso del producto bruto es de 36,4 g. - - - - -

5. El 2-aminobencimidazol se purifica por recristalización a partir de una disolución acuosa del mismo. Se añaden 36,4 g del producto bruto y 3,5 g de carbón vegetal ("MORIT" o "Carbo C extra") a 220 ml de agua y la mezcla se hierve y se agita durante 30 horas y luego se filtra. El filtrado se enfría hasta 5-10°C y se agita a
10. esta temperatura durante 2 horas. El producto precipitado se filtra, se lava con dos porciones de 5 ml de hielo-agua y se seca. Se obtienen 23,5 g (80,0%) de un producto blanco y puro. Punto de fusión: 228 a 230°C. - - - - -

15. A los efectos consiguientes se declaran de novedad y propiedad para España, sus territorios y plazas de soberanía, las reivindicaciones que siguen. - - - - -



REIVINDICACIONES

5. 1.- Procedimiento para la preparación de 2-amino  
 bencimidazol, caracterizado porque comprende hacer reaccionar  
 bajo calentamiento 2-metoxicarbonilaminobencimidazol con una  
 disolución acuosa de bromuro de hidrógeno y ajustar subsi-  
 guientemente el pH de la mezcla de reacción a unos 9 con una  
 disolución acuosa de hidróxido de metal alcalino. - - - - -

10. 2.- Procedimiento según la reivindicación 1, carac-  
 terizado porque comprende utilizar la disolución acuosa de  
 hidróxido sódico como disolución acuosa de hidróxido de metal  
 alcalino. - - - - -

3.- "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE 2-AMINO-  
 BENCIMIDAZOL". - - - - -

15. Todo ello conforme se describe y reivindica en la  
 presente memoria que consta de cinco hojas foliadas y mecano-  
 grafiadas por una sola de sus caras.

MADRID, 28 DIC. 1977

P.A.H. CURELL SUÑOL

