



P. 4.488 :

Case NP-23-Nº 38266

172077

MALA REPRODUCCION
POR DEFECTO DEL ORIGINAL

172077
-8 ENE. 1946

MEMORIA DESCRIPTIVA
para solicitar
P A T E N T E D E I N V E N C I O N
en
E S P A Ñ A
por VEINTE años
a nombre de HOFFMANN-LA ROCHE INC., entidad norteamericana, es-
tablecida en Roche Park, Nutley, Nueva Jersey, ESTADOS UNIDOS
DE AMERICA, por:
"UN PROCEDIMIENTO DE PRODUCIR UNA PENTOSA
"TRIACILICA".

=====:

Este invento se refiere a la preparaci3n de pentosas triacilicas desconocidas hasta ahora.

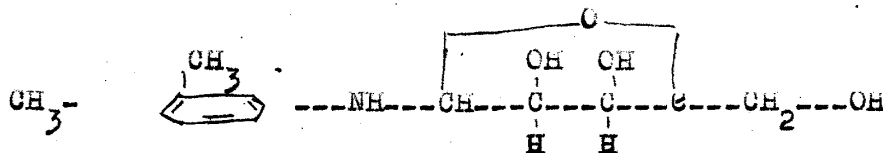
En la solicitud n3mero 172.075 pendiente con 3sta, se describe una nueva clase de N-pentosidas aminicas (-arom3ticas, a las cuales los inventores han asignado la f3rmula probable de piranosidas:



172077

ción a la sustitución de la posición 5 en pentosas, y así forma un valioso instrumento para promover el estudio científico de las pentosas.

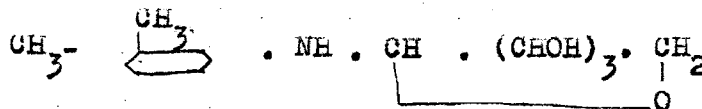
5 Kuhn y Birkofer en Ber. 71, 629 (1938) han descrito otra clase de N-pentosidas que se forma en solución por condensación de una amina aromática primaria y una pentosa con aplicación de calor. Se dice en la citada solicitud pendiente con ésta que, para demostrar el hecho de que las dos N-pentosidas representan clases diferentes, la combinación formada
10 calentando juntas ribosa y 3,4-dimetil-anilina en solución alcohólica, según la describen Kuhn y Birkofer, se comparó por la combinación resultante de la condensación de los componentes a la temperatura ambiente según el procedimiento de dicha solicitud pendiente con ésta. La primera combinación tiene
15 la probable fórmula de una furmosida



y las características

21
20 $\left[\infty \right] D = + 172^\circ$ (C = 0.5 en piridina)
P.f. 128 - 130°

al paso que la fórmula probable de la combinación de dicha solicitud pendiente con ésta es la de una pirasonida:



25 con las características:



846

172077

$$\left[\alpha \right]_D^{25} = + 94.5^{\circ} \longrightarrow + 53.0^{\circ} \text{ (c = 1.0 en piridina)}$$

P. F. 110 - 120° C

Se ha descubierto que es posible obtener pentosas 2,3,4- y 2,3,5-triacilicas de las dos clases de N-pentosidas triaciladas por hidrolisis.

Con arreglo al invento, se ofrece un procedimiento de producir una pentosa triacilica que comprende calentar una N-triacil-pentosida aminica aromática primaria en solución dentro de un campo de pH entre 2 y 8 aprox., en presencia de agua hasta que la hidrolisis está virtualmente completa, separar la amina libertada y aislar la pentosa triacilica de la solución acuosa.

Esta hidrolisis puede efectuarse sometiendo a reflujo la N-pentosida triacilada en solución o suspensión acuosa o alcoholica acuosa hasta que la hidrolisis se completa, como puede determinarse, si es necesario, por observación polarimétrica. La descomposición de la N-pentosida triacilada puede facilitarse enlazando la amina libertada con un aldehído presente durante la reacción, tal como benzaldehído aromático sustituido, formaldehído y similares. Ventajosamente puede también añadirse una pequeña cantidad de un ácido graso inferior volátil, tal como el fórmico, el acetico, o el propiónico, o vestigios de ácidos fuertes, aunque estos últimos causan alguna descomposición de las pentosas, particularmente de la ribosa. La presencia de una atmósfera no oxidante es ventajosa. Esto puede conseguirse desalojando el aire con CO₂ o N₂.

Los siguientes ejemplos ilustran el invento:



172077

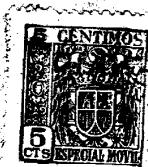
amarillento a la temperatura ambiente, que fluye a 60°. Esto rinde 2.3 g (88.9 %) de 2,3,5-triacetil-N-d-ribofuranosida.

3 g de 2,3,5-triacetil-N-d-ribofuranosida se suspenden en 200 cm³ de agua y 1 cm³ de ácido acético glacial. La mezcla se destila al vapor para separar la anilina, pasando a solución en unos pocos minutos la siruposa triacetil-furanosida. Después de separar toda la anilina el licor del frasco se filtra después de tratarlo con una pequeña cantidad de norita y una solución acuosa clara se evapora a sequedad y se seca recogiendo en alcohol y separando el disolvente varias veces. La 2,3,5-triacetil-ribofuranosa es un jarabe.

Según se usa aquí, "acilo" significa residuos acilícos de la serie de ácidos grasos inferiores tales como acetilo, propionilo y similares, y residuos acilícos de la serie benzoénica, tales como benzoilo, p-metoxibenzoilo y p-nitrobenzoilo.

Se comprenderá que pueden introducirse varias modificaciones en los procedimientos específicos descritos sin apartarse de la finalidad del invento.

Esta solicitud, que corresponde a la presentada en los Estados Unidos de América, el 30 de septiembre de 1943, bajo el número 504.444, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto de Propiedad Industrial.



1946

172077

-o- N O T A -o-

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Invención en España por VEINTE años, son los siguientes:

5
1º - Un procedimiento de producir una pentosa triacilica, caracterizado por calentar una N-triacil-pentosida aminica aromática primaria en solución dentro de un campo de pH entre 2 y 8 aprox., en presencia de agua hasta que la hidrolisis es virtualmente completa, separar la amina liberada y aislar la pentosa triacilica de la solución acuosa.

10
2º - Un procedimiento según se reivindica en el punto 1º., caracterizado por el hecho de que la solución es una solución o suspensión alcohólica acuosa.

15
3º - Un procedimiento según se reivindica en los puntos 1º o 2º., caracterizado por el hecho de que la hidrolisis se efectúa sometiendo la solución a reflujo.

20
4º - Un procedimiento según se reivindica en el punto 3º., caracterizado por el hecho de que la reacción se efectúa en presencia de un aldehido para combinar la amina liberada.

5º - Un procedimiento según se reivindica en los pun-

1
MALA REPRODUCCION
FOR DEFECTO DEL ORIGINAL



172077

tos 1º o 2º,, caracterizado por el hecho de que la hidrólisis y la separación de la amina libertada se efectúan destilando al vapor la solución.

5 6º.- Un procedimiento según se reivindica en cualquiera de los puntos anteriores, caracterizado por el hecho de que la reacción se efectúa en presencia de una pequeña cantidad de un ácido graso inferior volátil.

10 7º.- Un procedimiento según se reivindica en cualquiera de los puntos anteriores, caracterizado por el hecho de que la reacción se efectúa en presencia de una atmósfera no oxidante.

8º.- Un procedimiento de producir una pentosa tricilica.

15 Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de ocho hojas escritas por una sola cara.

Madrid,

5 SEP. 1946

P. A.

Alberto de Elzaburz

Profesor