

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



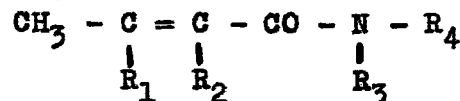
27 JUN

178662

por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE PRODUCTOS DESINFECTANTES", a favor de la razón social suiza J.R. GEIGY A.-G., domiciliada en Basilea (Suiza).-

## MEMORIA DESCRIPTIVA

Se ha encontrado que los compuestos de la fórmula general



5.

en la cual significan

$\text{R}_1$  y  $\text{R}_2$  hidrógeno, o metilo,

$\text{R}_3$  hidrógeno, o alquilo, y

$\text{R}_4$  un radical fenilo, eventualmente, substituído

10.

por grupos no-halógenos,

surten un efecto altamente bactericida, o una enérgica acción que impide el crecimiento (desarrollo) sobre diversos agentes infecciosos, como vg. los estreptococos y estafilococos. El efecto contra el Staphylococcus aureus se muestra a base de unos resultados de ensayos.

15.

178662



Comprobaciones, respecto del efecto bacteriostático, efectuadas con arreglo a un método de placas, modificado, según Flemming:

5.

Compuesto (de a.5 mgs. c/u.)	Anillo de impedimento
N-etil-anilida de ácido crotonico	4 mm
N-etil-anilida de ácido dimetilacrilico	5 mm
N-etil-o-toluidida de ácido crotonico	8 mm
Substancia de comparación: oxiquinolina de cloruro iódico	5 mm

10.

15.

Las amidas de la composición definida están, en parte, conocidas. Pueden ser obtenidas, vg., por transformación de cloruros de ácidos carboxílicos, no saturados en  $\alpha$ ,  $\beta$ , respectivos, con anilina, sus homólogos, y sus derivados sustituidos por grupos no-halógenos. Por grupos no-halógenos en el sentido de la definición anterior, se entenderán, por ejemplo, halógeno, grupos nitro, -cianógeno, -alquilo, -alcoxi, -carbalcoxi, -acilo, -acilamino, etc.

20.

25.

Como sea que estos compuestos son a la vez prácticamente inodoros, ni producen, en aplicación conveniente, irritaciones cutáneas de ninguna índole, ni otros fenómenos nocivos, resultan extraordinariamente adecuados como componente activo para la preparación de desinfectantes, los cuales pueden ser empleados en todos los casos en que la aplicación de desinfectantes sea necesaria o deseable. Así, se puede desinfectar con los mismos, vg., ropa blanca y prendas de ves-

30.

178662



21  
tir, vajilla (trastos) y otros objetos de uso, habitaciones, instrumentos y medios auxiliares médicos, así como partes del cuerpo de seres humanos y animales.

Según la finalidad del empleo, pueden ser preparados estos desinfectantes en diversas formas de uso:

5.

Así, basta para determinadas finalidades, con aplicar el componente activo sobre un vehículo fijo (sólido), como por ejemplo, blanco de España, caolín, bentonita, magnesia, ácido bórico, lactosa, clases de fécula, etc. Pero también

10.

se pueden emplear como vehículo, muchas otras materias sólidas, como vg., tejidos, algodón, hojas de papel o celulosa hidrosoluble, y similares. Para la preparación de estas formas se puede mezclar la sustancia activa en estado líquido o

15.

sólido directamente con el vehículo, o se puede impregnar el vehículo con una solución de la sustancia activa en un disolvente volátil, después de lo cual el disolvente es separado por calentamiento, y/o respectivamente, por evacuación.

20.

Si se desea una forma de aplicación líquida, se puede emulsionar o suspender el componente activo con adición de emulgentes (medios emulsivos) - o dispersantes, en agua. Como emulgentes o dispersantes, pueden emplearse, especialmente: compuestos aniónicos, vg., sales de ácidos grasos saturados o no saturados, o bien de ácidos carboxílicos etéreos, de peso molecular más elevado; sulfonatos de alcoholes grasos y sus

25.

sales, así como compuestos afines, como vg., sulfonatos de éster de ácido graso, ácidos sulfónicos aromáticos e hidroaromáticos alquilizados en su núcleo; además, éster de ácido fosfórico. Como compuestos catiónicos entran en consideración:

30.

compuestos amónicos cuaternarios con un radical alifático de elevado peso molecular, como por ejemplo, sales de piridinio-



178662

5. -alquilo, y otros similares más. Los emulgentes no-ionógenos, como vg. productos de condensación a base de óxido de etileno con compuestos alifáticos o aralifáticos, vg., el producto de condensación a base de óxido de etileno y alcohol esteárico, pueden emplearse también.

10. Igualmente es posible lograr soluciones claras y estables en agua, por empleo de agentes intermediarios de disolución. Además, se pueden producir soluciones en disolventes orgánicos de elevado punto de ebullición, como aceite de parafina, aceite de oliba, aceite alcanforado o similares. Desde luego, pueden emplearse también mezclas de disolventes, vg., que contienen glicerina.

15. A menudo se deseará obtener productos de concentración que puedan ser mezclados, inmediatamente en el lugar de su empleo, con agua u otros diluentes apropiados. Para esta finalidad, se puede mezclar la substancia activa con medios de humectación, agentes intermediarios de disolución y/o respectivamente, o emulgentes, así como en caso deseado, con otras materias adicionales más. Por agitación con agua, se obtienen 20. a base de estas preparaciones, emulsiones, suspensiones, o soluciones, dispuestas para el uso.

25. Además, se puede convertir el componente activo en preparaciones en forma de crema, pasta o unguento, vg., con vaselina, lanolina, o similares, o por medio de mezclas de tales materias, en caso deseado con adición de disolventes líquidos (vg. aceite de parafina). Pero también se puede producir emulsiones de consistencia a modo de pomada, vg., con empleo de ácido esteárico, sales de ácidos grasos, y agua. Para la preparación de pomadas libres de grasa, se puede emplear bases 30. de éteres celulósicos u otras materias hinchables de origen



178662

27 JUN 5

animal, vegetal, o sintético, y agua, o bien materias inorgánicas, como vg. gel de hidróxido de aluminio, en las cuales van mezclados en la elaboración los componentes activos, en caso de necesidad, recurriendo a emulgentes y/o disolventes.

5. Además, es posible aplicar el componente activo en forma de aerosoles. Al efecto, puede ser pulverizada la sustancia, en caso dado, disuelta en un disolvente apropiado, por medio de gases comprimidos. En la mayoría de los casos resulta más favorable disolver el componente activo en una sustancia fluidificada por presión, y, o respectivamente, o enfriamiento, gaseosa a temperatura interior y presión atmosférica, vg. cloruro de metilo, o freón, en caso deseado con adición de otros disolventes más. Por pulverización de tales soluciones de presión, se obtienen aerosoles que se prestan especialmente para la desinfección de locales cerrados, o bien para desinfectar ropa blanca o prendas de vestir, y similares, en locales cerrados.
- 10.
- 15.

Se sobreentiende que estas formas de aplicación pueden modificarse en algunos aspectos. Así, se puede vg., transformar el componente activo, primero, en vez de emulsionarlo o suspenderlo directamente, en una solución, no emulsionando sino ésta en agua. Igualmente se puede llevar el componente activo a un vehículo sólido, y suspender esta combinación en agua.

- 20.
25. En todo caso, se puede aplicar en lugar de un solo componente activo, una mezcla de varias de las combinaciones definidas, o bien adicionar otras sustancias bactericidas y/o fungicidas más. El efecto bactericida puede ser ensanchado, vg. por adición de fenoles, como p-cloro-m-cresol, o-butil-p-cloro-fenol, o-bencil-p-cloro-fenol, cloro-xilenol, ciclohexilfenol, oxidifenilo, y similares. Sin embargo, los componentes activos,
- 30.



27 Jun

178662

5. definidos al principio, también pueden ser combinados asimismo con muchas otras materias desinfectantes, vg., con compuestos amónicos cuaternarios, derivados de oxiquinolina, preparaciones a base de mercurio, preparaciones a base de plata coloidales, ácido de sulfocianuro de hidrógeno, y otros. Además, pueden entrarse en el empleo, otras materias de adición inactivas, como vg. materias adhesivas, agentes intermediarios de disolución, medios de humectación, etc. En caso especiales, las materias auxiliares empleadas, como vg. medios de humectación, pueden acusar, ellas mismas, propiedades bactericidas.
- 10.

También puede ser conveniente, teñir las preparaciones obtenidas por adición de colorantes, o substancias teñidas, o perfumarlas por adición de perfumes.

15. En los Ejemplos siguientes, se describe más detalladamente la preparación de diversas formas de desinfectantes, sin limitar con éllo la invención a estos Ejemplos. Las partes indicadas siempre han de entenderse como partes en peso.

EJEMPLO 1.

20. 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico (Pto. eb.  $13^{153-155^{\circ}}$ ), son mezcladas con 8,5 partes de sulfonato-éster-ácido graso, y 84,5 partes de agua. Se origina una solución prácticamente clara, estable, probablemente coloidal.

25. En vez de esta solución de uso, se puede asimismo preparar un producto de concentración, vg., a base de 45 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico y 55 partes de sulfonato-éster-ácido graso. Al diluir con agua se va formando, primero, una emulsión, que no obstante se va transformando en una solución, si se adiciona agua suficiente, para que la concentración del componente activo importe aproximadamente un 7%.
- 30.

178662



27 JUN

EJEMPLO 2.

5. Por mezcla de 15 partes de sulfonato de alcohol graso, preparado a base de un alcohol graso con una cadena de carbono de 6-10 átomos C, 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, y 78 partes de agua, se obtiene una emulsión.

EJEMPLO 3.

10. Por agitación de 30 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico con 70 partes de jabón de potasa, se obtiene una pasta homogénea. Por dilución con agua, se obtiene una suspensión que se presta como líquido de lavado, con propiedades desinfectantes.

EJEMPLO 4.

15. Por agitación de 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, con 93 partes de solución alcohólica de jabón, se obtiene una solución clara. Se puede asimismo preparar soluciones de una concentración más alta, las cuales se transforman, al ser diluidas con agua, en emulsiones.

20. En vez de 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, se puede asimismo emplear 5 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, y 2 partes de cloro-xilenol.

EJEMPLO 5.

25. 1,4 partes de p-tolil-dodecil-trimetil-amonio-metosulfato, y 49 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, son disueltas en 49,6 partes de alcohol. Esta solución clara, al diluirla con agua, una emulsión que sirve para la desinfección de enseres de toda clase.

EJEMPLO 6.

30. 8 partes de parafina, 15 partes de ácido esteárico, 5 partes de lanolina y 2 partes de cera, son calentadas juntamente a 80°. A esta temperatura, se introduce, amasando, 3 par-



1786621

5. tes de glicerina, 1 parte de trietanolamina, 58,5 partes de agua (previamente calentada a 80°), y 0,5 partes de amoníaco concentrado. La base de pomada terminada, es amasada con 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico, por lo cual es obtenida una crema homogénea de propiedades bactericidas.

EJEMPLO 7.

10. 80 partes de N-etil-anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico (Pto. de fus. 43°), son trituradas íntimamente con 20 partes de talco. Este producto de concentración puede emplearse como polvo de espolvorear directamente para fines de desinfección. No obstante, aún puede ser ulteriormente diluido, vg., con bentonita.

Por adición de urea, se obtiene un polvo de espolvorear de una eficacia particularmente buena.

15. EJEMPLO 8.

93 partes de bentonita son embebidas con una solución de acetona de 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico. El disolvente es separado, seguidamente, en el vacío. Se obtiene un polvo desinfectantes, propio para espolvorear.

20. EJEMPLO 9.

Por mezcla de 10 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico con 90 partes de aceite de oliva, se obtiene una solución clara, que puede emplearse para fines de desinfección.

EJEMPLO 10.

25. Se hace hinchar 3 partes de celulosa de metilo en 90 partes de agua caliente, mezclando la masa obtenida íntimamente con 7 partes de N-etil-o-toluidida de ácido crotónico. De este modo se obtiene una pomada desinfectante, libre de grasa. En lugar de la celulosa metílica, pueden emplearse asimismo otras materias hinchables, como tragacanto, gelatina, o alginatos.
- 30.

178662



27

EJEMPLO 11.

5. 7 partes de N-metil-anilida de ácido crotónico (pts eb. 13145-148<sup>8</sup>), son amasadas con 93 partes de Vaselinum flavum, hasta la dispersión uniforme. Se obtiene una pomada con buena acción bactericida.

EJEMPLO 12.

10. 5 partes de N-metil-anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico (pts eb. 13145-146<sup>2</sup>), son disueltas, bajo presión, en 5 partes de aceite de sésamo, y 90 partes de freón. Esta solución de presión puede emplearse, pulverizada mediante bombas de aerosoles, para la desinfección de locales.

- . -

15. En los Ejemplos citados, pueden emplearse, en lugar de los componentes activos indicados, asimismo otros del grupo definido al principio. Además de los citados, se prestan los compuestos siguientes:

20. Anilida de ácido crotónico, N-etil-anilida de ácido crotónico, N-propil-anilida de ácido crotónico, N-iso-amil-anilida de ácido crotónico, o-toluidida de ácido crotónico, p-toluidida de ácido crotónico, N-metil-o-toluidida de ácido crotónico, N-etil-m-toluidida de ácido crotónico, N-metil-p-toluidida de ácido crotónico, N-etil-p-toluidida de ácido crotónico, m-etil-anilida de ácido crotónico, o-anisidida de ácido crotónico, N-etil-o-anisidida de ácido crotónico, p-anisidida de ácido crotónico, N-butil-p-anisidida de ácido crotónico, N-metil-m-xilidida de ácido crotónico, N-metil-o-cloro-anilida de ácido crotónico, N-etil-p-bromo-anilida de ácido crotónico, N-etil-3,4-dicloro-anilida de ácido crotónico, 4-metil-2-cloro-anilida de ácido crotónico, N-etil-2-metil-6-cloro-anilida de ácido crotónico, p-isopropoxi-anilida de ácido

25.

30.

178662



27 JUN

- crotónico, N-metil-2-acetoxi-anilida de ácido crotónico,  
N-etil-2-carbometoxi-anilida de ácido crotónico, N-etil-4-ciano-  
-anilida de ácido crotónico, N-metil-o-nitranilida de ácido  
crotónico, N-propil-p-acetamino-anilida de ácido crotónico,  
5. anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-metil-anilida de  
ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-isobutil-anilida de ácido  
 $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-etil-o-toluidida de ácido  $\beta, \beta$ -dime-  
tilacrílico, N-etil-p-toluidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico,  
N-etil-m-toluidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-isopropil-  
-o-toluidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-isoamil-o-tolui-  
10. dida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-metil-p-toluidida de  
ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-metil-o-toluidida de ácido  
 $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, m-toluidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrí-  
lico, p-cloroanilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-metil-o-  
15. -cloro-anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-etil-2-metil-  
-6-cloro-anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, 2-etil-anilida  
de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-etil-3-etil-anilida de ácido  
 $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-etil-m-xilidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetil-  
acrílico, 2-bromo-anilida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico,  
20. N-etil-o-anisidida de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, p-fenetidida  
de ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, N-(2-ciano-fenil)-amida de  
ácido  $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, p-carbetoxi-anilida de ácido  
 $\beta, \beta$ -dimetilacrílico, anilida de ácido trimetilacrílico,  
N-metil-anilida de ácido trimetilacrílico, N-n-butyl-anilida  
25. de ácido trimetilacrílico, N-metil-o-toluidida de ácido  
trimetilacrílico, N-etil-o-toluidida de ácido trimetilacrílico,  
N-metil-p-toluidida de ácido trimetilacrílico, N-etil-m-tolui-  
dida de ácido trimetilacrílico, m-xilidida de ácido trimetil-  
acrílico, N-etil-o-anisidida de ácido trimetilacrílico, N-metil-  
30. -p-anisidida de ácido trimetilacrílico, N-etil-p-fenetidida de

178662-11-



178662

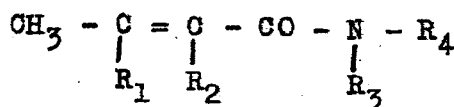
5. ácido trimetilacrílico, 2,5-dicloro-anilida de ácido trimetilacrílico, N-propil-3,4-dimetoxi-anilida de ácido trimetilacrílico, N-metil-3-aceto-anilida de ácido trimetilacrílico, N-etil-4-acetoxi-anilida de ácido trimetilacrílico, p-toluidida de ácido  $\alpha$ -etiliden-propiónico, N-isopropil-o-toluidida de ácido  $\alpha$ -etiliden-propiónico, N-etil-o-anisidida de ácido  $\alpha$ -etiliden-propiónico.

10. Como es natural, queda sobreentendido que la protección que se recaba para la invención, no queda limitada a los ejemplos de ejecución práctica indicados en la descripción, pues la protección se extiende a todas aquellas formas equivalentes de ejecución basadas en la solución lograda por el invento.

N O T A

15. Hecha la descripción del presente invento, se hace constar como nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, y se declara esta solicitud acogida a los derechos de prioridad de la patente N° 13298, depositada en SUIZA en fecha 28 de Junio de 1946.

20. 1ª.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado porqué se mezcla un compuesto (substancia activa) de la fórmula general



en la cual significan

R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub>            hidrógeno o metilo,

R<sub>3</sub>                    hidrógeno o alquíl, y

25.

178662



178662

R<sub>4</sub> un radical fenilo, eventualmente substituído por grupos que no forman sales,

sólo o juntamente con otras sustancias activas, con por lo menos un dispersante inerte, adecuado para la preparación de los productos, efectuándose, eventualmente, mediante homogeneización la transformación en forma finamente dispersada, o finamente dispersable.

5.

2<sup>a</sup>.- Procedimiento según la reivindicación 1<sup>a</sup>, caracterizado por el hecho de emplear una amida ácida alquilizada en el nitrógeno.

10.

3<sup>a</sup>.- Procedimiento según la reivindicación 1<sup>a</sup>, caracterizado por el hecho de emplear la N-etil-o-toluidida de ácido crotonico.

15.

4<sup>a</sup>.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado por el hecho de mezclar un compuesto (sustancia activa) de la fórmula definida en la reivindicación 1<sup>a</sup>, con una materia vehículo sólida, pulverulenta y, eventualmente, con otras sustancias adicionales más, homogeneizando eventualmente.

20.

5<sup>a</sup>.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado por el hecho de mezclar un compuesto (sustancia activa) de la fórmula definida en la reivindicación 1<sup>a</sup>, con un diluyente líquido o semisólido, inerte, no fácilmente inflamable y no tóxico, eventualmente, con adición de otras materias adicionales más, efectuando, en caso de necesidad, mediante homogeneización, la transformación en forma finamente dispersada, o finamente dispersable.

25.

6<sup>a</sup>.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado por el hecho de que para obtenerlos en forma de líquido pulverizable (aerosol), se dispersa un

30.

178662



compuesto (substancia activa) de la fórmula definida en la reivindicación 1ª, en un disolvente orgánico que hierve con presión de atmósferas a temperatura interior, eventualmente con adición de otras materias adicionales más.

5.

7ª.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado por el hecho de transformar un compuesto (substancia activa) de la fórmula definida en la reivindicación 1ª, con ayuda de un dispersante o emulsionante y, eventualmente, con adición de otras materias adicionales

10.

más, en forma finamente dispersable, que al ser mezclada con un medio líquido, de preferencia agua, da una dispersión homogénea.

15.

8ª.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes, caracterizado por el hecho de combinar un compuesto (substancia activa) de la fórmula definida en la reivindicación 1ª, con otras sustancias de efecto acaricida, insecticida, ovicida, fungicida y/o bactericida y, eventualmente, con otros dispersantes y materias adicionales más, transformando, eventualmente, por homogeneización en forma

20.

finamente dispersable.

9ª.- Procedimiento para la obtención de productos desinfectantes.

25.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de tres hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 27 de Junio de 1947.

J.R. GEIGY A.-G.

p.a.