

Nº 1.958

Expediente núm.

240675

240675



REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

PATENTE DE INVENCIÓN

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de

una **PATENTE DE INVENCIÓN** por **VEINTE** años, en España

a favor de

JOH. A. BENCKISER G.m.b.H. Chemische Fabrik, de nacionalidad
alemana domiciliado en **LUDWIGSHAFEN a.Rh. (Alemania)**
calle de **Frankenthaler Strasse**, núm. **3**

por:

"Procedimiento para la obtención de derivados de la
hidrazida del ácido cianacético terapéuticamente activos".

Nº 5947

Agente Sr. **Fernandez Candelas**.

240675

12 MAR 1933



240675

MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Invención a nombre de:
JCH. A. BENCKISER G.m.b.H. Chemische Fa-
brik, de nacionalidad alemana, domicilia-
da en LUDWIGSHAFEN a.Rh., Frankenthaler
Strasse, 3, (Alemania); por: "PROCEDIMIE-
TO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE LA
HIDRAZIDA DEL ACIDO CIANACETICO TERAPEUTI-
CAMENTE ACTIVOS".-

... ..

Se ha descubierto que los derivados de la hidra-
zida del ácido cianacético que se originan mediante reac-
ción con hidratos de carbono generadores de hidrazonas, a
saber aldosas y cetosas, por ejemplo hexosas, pentosas, ce-
5 tosas y similares, glucósidos, disacáridos, polisacáridos,
celulosas, hemicelulosas, fécula, glicógeno y sus productos
de hidrólisis con hidrazida del ácido cianacético, se dis-
tinguen por sus propiedades terapéuticas valiosas y tienen
acción por ejemplo contra la tuberculosis y otras infec-
10 ciones.

Según el invento las nuevas combinaciones se ob-
tienen haciendo reaccionar hidratos de carbono generadores

240675

- 2 -



12 MAR 1952

15 de hidrazona, por ejemplo aldosas o cetosas con hidrazida del
ácido cianacético en condiciones condensadoras. Los componen-
tes de partida se ajustan preferentemente en cantidades equi-
moleculares. La reacción tiene lugar preferentemente en un
disolvente inerte adecuado, por ejemplo alcohol con o sin
calefacción, en presencia o ausencia de catalizador. La sín-
20 tesis puede, sin embargo, realizarse también en materiales
de partida disueltos, por ejemplo en una suspensión o masa
fundida. Los hidratos de carbono adecuados para la transfor-
mación pueden estar unidos, sustituidos o esterificados o
parcialmente esterificados con grupos terapéuticamente acti-
vos, y/o metales, por ejemplo con ácido fosfórico, ácido
25 pirofosfórico y otros ácidos de fósforo condensados, ácido
cítrico, ácido tartárico, o pueden contener también otros
grupos funcionales o convertirse posteriormente en derivados
ácidos. Se obtienen combinaciones nuevas muy activas, cuando
los hidratos de carbono de la hidrazida del ácido cianacético
30 sustituidos y capacitados para la formación de sales se hace
que originen en forma de sus sales o se convierten en sus
sales.

Ejemplo 1.-

35 3,6 g de galactosa y 2,0 g de hidrazida del ácido
cianacético se calientan al baño maría en 40 cm³ de metanol.
Después de unas 2 horas se forma una disolución clara y si-
guiendo calentando, se separa cristalino el producto de la
reacción. El rendimiento en hidrazona galactosílica del
ácido cianacético es del 80%. La sustancia es muy poco solu-
40 ble en metanol y alcohol. Puede purificarse disolviéndola en
la menor cantidad posible de agua fría y precipitando con ace-
tona.

Punto de fusión = 181° (descomp.), sin corregir.



240675

12 MAR 1958

45 Ejemplo 2.-

1,5 g de 1-arabinosa y 1,0 g de hidrazida del ácido cianacético se calientan al baño maría con 20 cm³ de metanol. Dentro de 10 minutos se forma una disolución clara. Se calienta en total durante una hora y al enfriar y revolver se separa el producto de la reacción que se compone de arabinosil-hidrazona del ácido cianacético, con un rendimiento del 87%. La sustancia puede recrystalizarse en alcohol.

50

Punto de fusión = 168° (descomp.) sin corregir.

55 . . . N O T A . . .

Se reivindica como nuevo y de propia invención:

1.- Procedimiento para la obtención de derivados de la hidrazida del ácido cianacético terapéuticamente activos, caracterizado porque la hidrazida del ácido cianacético se hace reaccionar en condiciones condensadoras con hidratos de carbono generadores de hidrazona o con sus derivados.

60

2.- Procedimiento según lo reivindicado en el punto 1, caracterizado porque los productos de condensación de los hidratos de carbono con la hidrazida del ácido cianacético adecuados para la formación de sales se hace que se origine en forma de sus sales o se conviertan en sus sales.

65

3.- Procedimiento para la obtención de derivados de la hidrazida del ácido cianacético terapéuticamente activos.

Tal como se describe y reivindica en la presente Memoria Descriptiva que consta de tres hojas escritas a máquina por una sola cara.

70

Madrid, 12 de Marzo de 1.958.

Carlo J. J. J.