

AÑO

Expediente núm.



246376

REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

PATENTE DE **INVENCION.**

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de

una **PATENTE DE INVENCION** por 20 años, en España

a favor de

MAY & BAKER LIMITED, entidad inglesa., de nacionalidad

..... domiciliado en **Dagenham, Essex**,

~~Inglaterra~~ **Inglaterra**. núm.

por:

..... "Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de la
isonicotinilhidracida".

Nº 12287

Agente Sr. **Gómez-Acebo y Modet**.

PATENTE DE INVENCION

CASE 347

2 463 76

7 ENE.



Memoria Descriptiva

sobre:

"Procedimiento para la preparación de un nuevo
"derivado de la isonicotinilhidracida".

=====

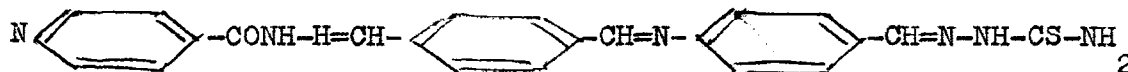
Solicitante: MAY & BAKER LIMITED. entidad inglesa, domiciliada en
Dagenham, Essex, Inglaterra.

=====

La presente invención se relaciona con un
procedimiento para la preparación de un nuevo derivado
de la isonicotinilhidracida.

5. Se sabe que la isonicotinilhidracida posee
propiedades antibactericas y que se utiliza particularmen-
te para el tratamiento de la tuberculosis.

Después de numerosos ensayos e investigaciones,
se ha descubierto ahora que el nuevo derivado de la
isonicotinilhidracida que responde a la fórmula





1959

- 2 -

2 463 76

es decir, la isonicotinilhidrazona de la formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina, posee propiedades antibactericas interesantes.

5. Como agente terapeutico utilizado en el tratamiento de la tuberculosis, el compuesto objeto de la presente invencion presenta cierto numero de ventajas interesantes:

10. Es una substancia monomera que contiene una cantidad determinada de isonicotinilhidracida y de tiosemicarbazona del para-aminobenzaldehido; los ensayos in-vitro han demostrado que posee una actividad parecida a la de la tiosemicarbazona del para-acetamido-benzaldehido, mientras que los ensayos in-vivo han demostrado que es extremadamente activa contra las cepas de Mycobacterium tuberculosis (como por ejemplo la cepa 15. Ba) resistentes a la isopicotinilhidracida.

20. Segun un modo de ejecucion del presente invento, el nuevo compuesto puede prepararse condensando la formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina con la isonicotinilhidracida. La formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina se obtiene por condensacion de la tiosemicarbazona del para-aminobenzaldehido con aldehido tereftalico en un disolvente conveniente y puede utilizarse en forma de la solucion en el seno 25. de la cual se ha formado.

La preparacion del nuevo compuesto se ilustra en el ejemplo siguiente:

E J E M P L O

30. Una solucion de 12,95 g. de tiosemicarbazona del para-aminobenzaldehido en 67 cm³ de dimetilformamida se



- agitó en una solución helada de 8,95 g. de aldehido tereftálico en 67 cm³ de dimetilformamida y se dejó reposar la mezcla durante una noche. La solución resultante de formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina
5. (que puede aislarse por precipitación con agua y recristalizarse en etanol en forma de cristales amarillos que funden a más de 360°) se trata con una solución fría de 9,1 g. de isonicotinilhidracida en 200 cm³ de dimetilformamida y se deja reposar la mezcla durante una noche. El
10. precipitado cristalino de bis-isonicotinilhidrazona del aldehido tereftálico se separa por filtración. Se obtienen 4,1 g. que, después de ebullición en etanol, forman cristales incoloros que funden a 357-358°. Se trata el filtrado con agua hasta que la mezcla se hace turbia
15. (alrededor de 1 litro). Después de varias horas, el producto cristalino amarillo que se forma y que es el monohidrato de la isonicotinilhidrazona de la formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina se separa por filtración y el filtrado se trata con un litro más de
20. agua para dar otra cantidad de producto. Los productos combinados se lavan en etanol; se hace hervir con 500 cm³ de etanol y durante una hora a fin de eliminar las impurezas restantes. El producto insoluble se recoge, se lava con etanol fresco y se seca. Se obtienen 16,3
25. g. de producto, PF > 300° (descomposición).

N O T A

- Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente
30. indicadas son susceptibles de modificaciones de

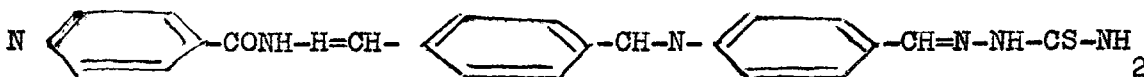


detalle, en cuanto no alteren su principio fundamental. Tambien se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de patente presentada en Inglaterra con fecha 17 de enero de 1958, nº 1751/58, acogiéndose,

- 5. por lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor y siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención, por 20 años en España: "Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de la isonicotinilhidracida"; caracterizándose por lo siguiente:

1º.- Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de la isonicotinilhidracida, de la formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina

- 15. de la fórmula



caracterizándose porque se condensa la formil-4' benzal tiosemicarbazonoformil-4 anilina con la isonicotinilhidracida.

- 20. 2º.- Procedimiento para la preparación de un nuevo derivado de la isonicotinilhidracida; tal y como queda substancialmente descrito en la presente memoria que consta de cuatro hojas, escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

MAY & BAKER LIMITED.

J. GOMEZ ACEBO Y MOBET
P. P.

7 ENE. 1959