

286 801



MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de un

PATENTE DE INVENCION

por VEINTE años en España, por "METODO DE PRODUCCION

DE $\sqrt{2-(5\text{-NITROFURFURILIDENO})\text{HIDRAZINO}}/\text{TIOFOSFATO O, O=}$

DIETILICO"

a favor de

The Norwich Pharmacal Company

domiciliado en 17 Eaton Avenue, Norwich, New York,

Estados Unidos

PRIORIDAD. de la solicitud de patente estadounidense
no. 185.237 del 5 de abril de 1962.

INVENTOR: Harry Raymond Snyder, Jr. de nacionalidad
estadounidense.

286801



Esta invención se relaciona con un nuevo compuesto químico, [2-(5-nitrofurfurilideno)hidrazino]tiofosfato O,O-diétilico, de fórmula:



con su preparación y con composiciones que contienen a dicho compuesto.

Este compuesto se distingue particularmente por sus propiedades antiprotozoarias. Estas propiedades le convierten en un valioso agente para combatir enfermedades de importancia en el campo de la veterinaria, tales como la coccidiosis en los pollos. Cuando se administra a éstos, infectados de Eimeria tenella, se evitan la morbilidad y mortalidad causadas por esa enfermedad. La administración de este compuesto a tales efectos puede llevarse a cabo muy convenientemente mediante su simple mezcla con el alimento proporcionado a tales aves.

15 Unas cantidades muy pequeñas incorporadas en el alimento, en la proporción del 0,011 al 0,03% aproximadamente en peso, sirven para producir el efecto deseado. Por ejemplo, cuando este compuesto se incorpora a un nivel del 0,022% en peso del alimento y éste se proporciona sin restricción a pollos mortalmente infectados con Eimeria tenella, se obtiene una protección del 75% de las aves contra los estragos de esa enfermedad.

20 La preparación del compuesto de esta invención se efectúa fácilmente agrupando 5-nitro-2-furaldehído y el hidrazidotionfosfato O,O-diétilico. El producto final se asegura en elevada producción y un buen estado de pureza.

25 De acuerdo con esta invención, el método de preparación actualmente preferido consiste en mezclar conjuntamente 5-nitro-2-furaldehído e hidrazidotionfosfato O,O-diétilico, preferiblemente en presencia de un diluyente inerte tal como benceno, en un adecuado recipiente de reacción. Para obtener un rendimiento óptimo de la reacción, es

30

286801



conveniente aplicar brevemente calor al recipiente de reacción. Cuando se completa la reacción, se enfría el contenido del recipiente, y a fin de favorecer una rápida cristalización del producto deseado, se añade un líquido precipitante, tal como exano. El producto deseado se recupera en forma convencional, como por filtración o centrifugación. Puede recristalizarse, si se desea, a partir de un disolvente adecuado, tal como isopropanol.

A fin de que esta invención pueda ser plenamente interpretada y comprendida por los expertos en el arte, se ofrece el siguiente ejemplo ilustrativo, pero no limitativo.

A: Preparación de hidrazidotionfosfato 0,0-dietílico.

En un matraz de 3 cuellos y 500 ml de capacidad, provisto de agitador, embudo de adición y condensador de reflujo, se introduce hidrato de hidrazina al 100% (50 ml, 50 g, 1,0 m-g). Se añade lentamente tiosfosforil cloruro dietílico (94 g, 0,5 m-g) a la hidrazina agitada. La reacción es exotérmica. Después de la adición, se agita y calienta (aproximadamente a 50-60°C) la mezcla durante una hora. Se enfría la mezcla a la temperatura ambiente y luego se añade agua (aproximadamente 300 ml). Se agita la mezcla durante quince minutos. Se separan las dos capas (el producto es la capa inferior) para producir 76 g (82,6%).

B: Preparación de 2-(5-nitrofurfurilideno)hidrazino tiosfosfato 0,0-dietílico.

Se introducen en un matraz 5-nitro-2-furaldehído (29 g, 0,2 m-g), hidrazidotionfosfato dietílico (36,8 g, 0,2 m-g) y benceno (aproximadamente 1000 ml). Se calienta la mezcla sobre un baño de vapor de agua durante quince minutos. Durante el calentamiento, se forma agua y una solución clara. Se enfría y diluye la solución con un gran volumen de exano. El producto es recogido y lavado con exano para dar 50g (81,5%), con punto de fusión de 95-97°C. La purificación puede efectuarse por recristalización a partir de isopropanol acuoso al 50%, con



p.f. del 101,5-102,5°C.

Análisis.- Calculado para $C_9H_{14}N_3O_5PS$: C, 35,18; H, 4,59; N, 13,68.

Observado: C, 35,46, 35,31; H, 4,76, 4,80; N, 13,40, 13,49.

REIVINDICACIONES

5

EN RESUMEN: La Patente de Invención que se solicita, deberá recaer sobre las siguientes reivindicaciones:

1.- Método de producción de $\lceil 2-(5\text{-nitrofurfurilideno})\text{hidrazino} \rceil$ tiofosfato 0,0-dietílico, que comprende la reacción de 5-nitro-2-furaldehído con hidrazidotionfosfato 0,0-dietílico.

10

2.- Método según la reivindicación 1, en el que la reacción se lleva a cabo en presencia de un diluyente inerte con cantidades aproximadamente equimolares de 5-nitro-2-furaldehído e hidrazidotionfosfato 0,0-dietílico.

15

3.- Por último se reivindica como objeto sobre el que ha de recaer la presente Patente de Invención que se solicita, por "MÉTODO DE PRODUCCION DE $\lceil 2-(5\text{-NITROFURFURILIDENO})\text{HIDRAZINO} \rceil$ TIOFOSFATO 0,0-DIETILICO".

20

Todo tal y conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de cuatro páginas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 5 de Abril de 1963

ALFONSO UNGRIA

P.P.

25

30