

CASE 1891⁺B



3064871

V. 1964

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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE SEMICARBAZONAS DE 5-NITRO-2-FURFURAL", a favor de la firma suiza J.R. GEIGY A.G., domiciliada en Basilea (Suiza).

= . =

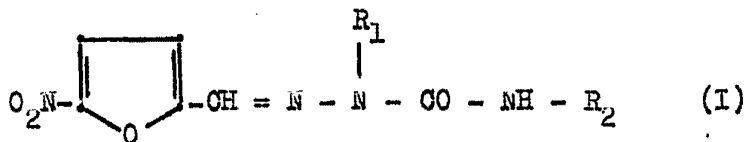
MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a nuevas semicarbazonas de 5-nitro-2-furfural, que poseen propiedades aprovechables farmacológicamente, en especial antimicrobicas, así como a procedimiento para su preparación.

5. Se ha hallado, que las semicarbazonas de 5-nitro-2-furfural de la fórmula general I



306487



5.

en la que

R₁ significa un radical de 2-hidroxi-1-cicloalquilo con 5 - 7 miembros en el anillo y 5 - 10 átomos de carbono y

10.

R₂ significa hidrógeno, un radical alquílico con 3 átomos de carbono a lo sumo, o un radical fenílico,

15.

poseen inmejorables actividades antimicrobica, en especial antimixótica y antibacterica. En organismos vivos son efectivas entre otras contra infecciones de estafilococos en general.

20.

En los nuevos compuestos de la fórmula general I R₁ significa, por ejemplo el radical 2-hidroxi-cicloheptílico o uno de estos radicales sustituidos mediante uno o dos grupos alquílicos inferiores, por ejemplo grupos metílicos, isopropílicos o butílicos terciarios. R₁ contiene en total 10 átomos de carbono a lo sumo. R₂

25.

significa por ejemplo hidrógeno, un radical metílico, etílico, n-propílico, isopropílico o el radical fenílico.

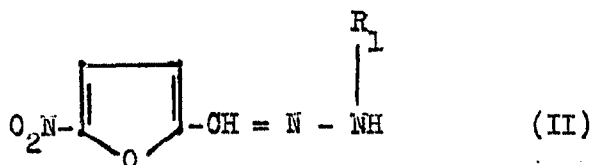
Los nuevos compuestos de la fórmula general I definida más arriba, se preparan al hacer reaccionar en un

306487



disolvente inerte, una hidrazona de la fórmula general
II

5.



10.

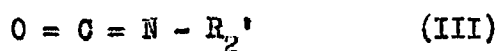
en la que

R_1 tiene la significación arriba indicada,

con ácido cianico o un isocianato de la fórmula gene-

15.

ral III



20.

en la que

R_2' significa un radical alquílico con 3 átomos de carbono a lo sumo o un radical fenílico.

25.

Gracias a sus propiedades antimicrobicas, los nuevos compuestos de la fórmula general I son bien utilizables como agentes antibactericos, antimicóticos y coxidostáticos. En forma concentrada o dispuesta para uso, muestran materia activa o adición de materia activa valiosa para preparados antibactericos, antimicóticos o coxidostáticos. Además se pueden incluir como profilácticos,

306487



materias orgánicas de todas clases, que suspenden el ataque de bacterias o mohos.

- El ejemplo siguiente aclara más detalladamente la preparación de los nuevos compuestos de acuerdo con la invención. En él las partes significan partes en peso.
- 5.

EJEMPLO

10. Una mezcla de 20 partes de N'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazona de 5-nitro-2-furfural y 9 partes de isocianato fenílico se calientan durante 1 1/2 horas en un baño de vapor. Luego se adicionan 100 partes de cloroformo y el precipitado amarillo se filtra, recristaliza en dimetilformamida acuosa al 60% y seca en vacío a 100° C. La 2'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-4'-fenil-semi-carbazona de 5-nitro-2-furfural, así obtenida, funde a 131° C (descomposición).
- 15.

20. La N'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazona de 5-nitro-2-furfural puede prepararse como sigue:

- Una mezcla de 8 partes de 5-nitro-2-furfural, 67 partes de ácido acético 0,5-n, 27 partes de etanol, y 10,7 partes de acetón-N'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazona se agita a temperatura ambiente durante una hora, luego se enfría a 5° C y se filtra la materia sólida de color rojo que precipita, y se seca en vacío a 40° C. Así se obtiene la N'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazona de 5-nitro-2-furfural, que funde a 56-58° C.
- 25.

La acetón-N'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazina puede prepararse como sigue: 93 partes de 2-(2'-hidroxi-

306487



- ciclopentil)-hidrazina se adicionan bajo refrigeración a 170 partes de acetona. Tras una hora de agitación a temperatura ambiente se destila la acetona excedente. Se obtiene del residuo mediante destilación, la acetona-N'-
5. (2"-hidroxi-ciclopentil)-hidrazona con un punto de ebullición de 86-87° C/0,2 torr.

Se obtienen de la misma forma

10. la 2'-(2"-hidroxi-ciclohexil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural, de punto de fusión 181-182°C,
la 2'-(2"-hidroxi-cicloheptil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural, de punto de fusión 164-165°C, y
la 2'-(2"-hidroxi-4"- (o 5"-) -metil-ciclohexil)-semicarbazona de 5-nitro-furfural, de punto de fusión 183-184°C.
- 15.

Igualmente se pueden preparar los compuestos siguientes:

20. la 2'-(2"-hidroxi-3"-metil-ciclopentil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural;
la 2'-(2"-hidroxi-5"-metil-ciclopentil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural;
25. la 2'-(2"-hidroxi-3",5"-dimetil-ciclopentil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural;
la 2'-(2"-hidroxi-3",4",5"-trimetil-ciclopentil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural;
la 2'-(2"-hidroxi-2"-metil-ciclohexil)-semicarbazona de 5-nitro-2-furfural;

306487



- 1a 2'-(2"-hidroxi-3"-metil-ciclohexil)-semicarbazona
de 5-nitro-2-furfural;
- 1a 2'-(2"-hidroxi-6"-metil-ciclohexil)-semicarbazona de
5-nitro-2-furfural;
5. 1a 2'-(2"-hidroxi-3",5"-dimetil-ciclohexil)-semicarba-
zona de 5-nitro-2-furfural;
- 1a 2'-(2"-hidroxi-4",6"-dimetil-ciclohexil)-semicarbazo-
na de 5-nitro-2-furfural;
- 1a 2'-(2"-hidroxi-3",6"-dimetil-ciclohexil)-semicarbazo-
na de 5-nitro-2-furfural;
10. 1a 2'-(2"-hidroxi-3",6"-dietil-ciclohexil)-semicarbazona
de 5-nitro-2-furfural;
- 1a 2'-(2"-hidroxi-ciclopentil)-4'-metil-semicarbazona de
5-nitro-2-furfural;
15. 1a 2'-(2"-hidroxi-ciclohexil)-4'-metil-semicarbazona de
5-nitro-2-furfural, y
1a 2'-(2"-hidroxi-cicloheptil)-4'-metil-semicarbazona
de 5-nitro-2-furfural.

306487



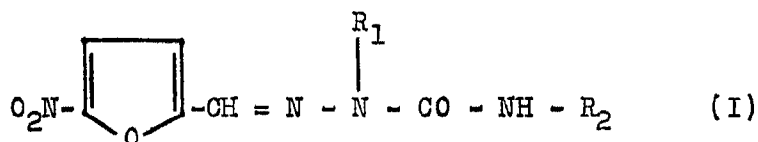
N O T A

Descrito el invento se declaran nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la demanda de patente inglesa Nº 46 971/63 del 28 de noviembre de 1.963.

5.

1. Procedimiento para la preparación de semicarbazonas de 5-nitro-2-furfural, de la fórmula general I

10.



15.

en la que

R_1 significa un radical 2-hidroxi-1-cicloalquílico con 5-7 miembros de anillo y 5-10 átomos de carbono y

20.

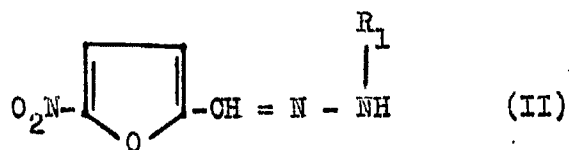
R_2 significa hidrógeno o un radical alquílico con 3 átomos de carbono a lo sumo, o un radical fenílico,

306487



caracterizado porque se hace reaccionar, en un disolvente inerte, una hidrazona de la fórmula general II

5.



10.

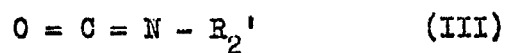
en la que

15.

R_1 tiene la significación arriba indicada,

con ácido cianico o un isocianato de la fórmula general III

20.



en la que

25.

R_2' significa un radical alquílico con 3 átomos de carbono a lo sumo o un radical fenílico.

2. Procedimiento para la preparación de semicarbazonas de 5-nitro-2-furfural.

306487



Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de nueve páginas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras, acompañadas de la documentación reglamentaria.

Madrid, a 27 de noviembre de 1.964.

P. a.

D. P. JAIME ISERN

A handwritten signature in black ink, consisting of a large, stylized loop followed by a horizontal line and a small upward tick.