



PATENTE DE INVENCION
=====

BAYER Le A 9174

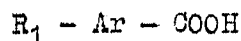
320896

Memoria Descriptiva
sobre

"Procedimiento para la preparación de derivados
carboxílicos de efecto antimicrobial."

Solicitante: FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, entidad
alemana, residente en: Leverkusen—Bayerwerk,
ALEMANIA.

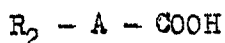
Ya es conocido que los ácidos carboxílicos
de fórmula general



en la cual Ar significa un resto aromático de uno
5. ó varios núcleos y R₁ significa uno o varios restos



- de alquilo, restos sustituidos de alquilo, hidrox*í*, halógeno, alcoxi, acilamino, sulfonilamino, formilo, ciano, carboxi, N-alquilcarboxilamida, N,N-dialquilcarboxilamida, carbalcoxi, restos halógeno-sustituidos de carbalcoxi,
5. arilcarbonilo o alquilmercapto, o ácidos carboxílicos de fórmula general



- en la cual A significa un resto alifático o cicloalifático saturado o sin saturar y R₂ uno o varios átomos de halógeno, restos de hidrox*í*, ciano, sulfonilamino, carboxi,
10. N-alquilcarboxilamina, N,N-dialquilcarboxilamida, carbalcoxi, restos halógeno sustituidos de carbalcoxi, alquilcarbonilo, carboxialquidisulfuro, carboxialquilmercapto, cianalquilmercapto o arilmercapto, tienen un efecto desinfectante y debido a estas propiedades, se pueden emplear por ejemplo en la limpieza química desinfectante.
- 15.

- Como compuestos de fórmula R₁ -Ar-COOH y R₂-A-COOH sean mencionados por ejemplo: El ácido 2-clorobenzoico, el ácido 2-bromobenzoico, el ácido 2,4-diclorobenzoico, el ácido 2,5-diclorobenzoico, ^{el ácido} 3,4-diclorobenzoico,
20. el ácido 4-cianobenzoico, el ácido 3-trifluormetilbenzoico, el ácido 2-metansulfonilaminobenzoico, el ácido 2-bencensulfonilaminobenzoico, el ácido 5-cloro-2-hidroxibenzoico, el ácido 2-etoxi-5-clorobenzoico, el ácido 5-cloro-2-hidrox
25. xi-3-metilbenzoico, el ácido difénico, el ácido 3,4-difenildicarboxílico, el ácido 4,4'-dihidroxi-3,3'-dimetil-trifenilmetanodicarboxílico, el ácido 2,6-dicloro-4,4'-dihidroxi-3,3'-dimetil-trifenilmetanodicarboxílico, el ácido 4-acetaminobenzoico, el ácido β -resorcílico, el ácido hidroquinon
30. -2,5-dicarboxílico, el ácido 3-metil-4-hidroxi-benzaldehídicarboxílico, el ácido 5,5'-metilenodisalicílico, el ácido



- 3, 4, 3', 4'-tetracloro-5,5'-metilenodisalicílico, el ácido tetracloroftálico, el tetracloroftalato monobutílico, el ftalato monometílico, el ftalamida monodimetílico, el ftalato mono-tricloroetílico, el ácido 3-clorotereftaloil-2-benzoico, el ácido 2-cloro-4-metilmercaptobenzoico, el ácido 2-clorometanosulfonilamino-benzoico, el ácido 2-hidroxinaftoico (1) y el ácido 2-hidroxinaftoico (3) ó bien al ácido malónico, el ácido cianacético, el ácido adípico, el ácido acelaico, el ácido sebácico, el ácido maleico, el ácido fumérico, el ácido cloropropiónico, el ácido ditioldi-propiónico, el succinato monometílico, el succinato monobu-tílico, el succinato mono- β -cloroetílico, el ácido lavíli-co, el acelainato monotricloroetílico, el maleinamida mono-dimetílico, el maleinato monometílico, el maleinato monodi-cloroetílico, el ácido canfórico, el ácido β -carboxietil-mercapto-acético, el ácido β -cianetilmercaptoacético, el ácido butilmercaptoacético, Δ 3-tetrahidroftalamida mono-dimetílica, ácido hexahidroftálico, ácido endometilenotetra-hidroftálico, ácido hexacloroendometilenotetrahidroftálico, Δ -3-tetrahidroftalamida mono-dimetílica y ácido 4-cloro-bencenosulfonilamino-acético. Hágase referencia por ejemplo a la patente francesa 1 364 297.

- Se ha descubierto ahora que los preparados que se obtienen cuando los ácidos carboxílicos de las fórmulas indicadas se calientan con paraformaldehído a 90 hasta 150°C en disolventes orgánicos se pueden emplear con mucho más éxito como medios antimicrobiales. Se dará preferen-cia a aquellos preparados que se han obtenido de los ácidos carboxílicos de las fórmulas indicadas con paraformal-dehído en proporción de 1 molécula-gramo de ácido carboxí-



lico por 0,5 hasta 3 moléculas-gramo de formaldehído em-
pleando disolventes orgánicos miscibles con agua.

- Como disolventes orgánicos correspondientes
sean mencionados: el glicol etilénico, dietilénico y pro-
5. pilénico así como los monoéteres de estos glicoles y los
alcoholes inferiores, monovalentes, tal como el alcohol
etilico y propílico.

- Los preparados de la presente invención son es-
pecialmente adecuados como materiales activos antimicrobiales
10. en la limpieza química desinfectante. Las cantidades ne-
cesarias se pueden determinar con facilidad mediante ensa-
yos previos; por lo general es suficiente una adición de
4 g de los preparados por litro de flota de limpieza.
Sorprendentemente resultan los preparados de la presente
15. invención también excelentemente adecuados para desgermi-
nar las emulsiones de taladrina y otras emulsiones propen-
sas a los microbios. Aquí es por lo general suficiente
una adición de 4 g de los preparados por litro de emul-
sión.

20. Las partes indicadas en los ejemplos siguientes
son partes en peso:

EJEMPLO 1

- Tejidos de algodón, lana, fibras de nitrilo
poliacrílico o fibras de poliamida sintética, que están
25. infectadas con *Stc. aureus*, *Bct. coli*, *Bct. proteus*,
Bct. pyocyanum y *Stro. glycerinaceus* se someten durante
20 minutos en proporción de flota 1:13 a una limpieza quí-
mica usual en percloroetileno o bencina pesada que por li-
tro contiene 5 g de reforzador de limpieza usual en el
30. mercado constituido a base de tensores anionactivos y no-



ionógenos y 4 g de uno de los preparados antimicrobiales descritos a continuación bajo a) hasta h).

La humedad relativa del aire en el recinto de vapor de la instalación de limpieza asciende aquí al 75 %. A conti-

5. nuación se centrifugan los tejidos y se secan. Los tejidos demuestran estar libres de gérmenes. Los preparados antimicrobiales que entran en consideración se prepararon de la manera siguiente:

10. a) 300 partes de ácido 2-clorobenzoico se disolvieron en 671 partes de éter etilenglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 29 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 140°C.
15. b) 300 partes de ácido 5-clorosalicílico se disolvieron en 642 partes de éter etilenglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 58 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 120°C.
20. c) 300 partes de ácido 2,4-diclorosalicílico se disolvieron en 656 partes de éter etilenglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 44 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 120°C.
25. d) 300 partes de dicloroftalato monoetílico se disolvieron en 664 partes de éter etilenglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 36 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 125°C.
30. e) 200 partes de ácido 2-hidroxinaftoico-(1) se disolvieron en 734 partes de éter etilenglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 66 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 135°C.



5. f) 200 partes de ácido 2-clorobenzoico y 100 partes de ácido 2-hidroxinaftoico-(1) se disolvieron en 629 partes de éter etilenoglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 71 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 130°C.

g) 300 partes de ácido acelaico se disolvieron en 653 partes de éter etilenoglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 47 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 120°C.

10. h) 300 partes de ácido canfórico se disolvieron en 641 partes de éter etilenoglicolmonopropílico, a continuación se agregaron 59 partes de paraformaldehído y la mezcla se calentó durante 15 minutos a 120°C.

15. Efectuando la limpieza química en lugar de con los preparandos según la presente invención con un aditivo de los ácidos carboxílicos en que se basan los preparados en una cantidad de 4 g por litro de flota de limpieza en tonces los tejidos no están después de la limpieza totalmente libres de gérmenes.

20. EJEMPLO 2

25. 2 partes de un aceite de taladrina usual en el mercado, que se compone de un aceite vegetal y un emulsio nador no-ionógeno se agitan con 98 partes de agua a una emulsión y a continuación se mezcla aún con 3 partes del preparado descrito en el ejemplo 1 bajo a). La emul sión está entonces excelentemente conservada. Por el con trario muestra la emulsión que se ha preparado sin la adi ción del preparado antimicrobial en su empleo usual ya des pués de pocos días un fuerte ataque por bacterias.

320896 - 7 -



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
5. indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental; también se hace constar que el invento se refiere a una Solicitud de Patente presentada en Alemania, con fecha 18 de diciembre de 1964, nº F 44.753 IVa/30i, accogiéndose por
10. lo tanto, a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España, sobre: "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE DERIVADOS CARBOXILICOS DE
15. EFECTO ANTIMICROBIAL"; caracterizándose por lo siguiente:
- 1ª.- Procedimiento para la preparación de derivados carboxílicos de efecto antimicrobial; caracterizado porque un ácido carboxílico de fórmula general
- R-COOH
20. donde R significa R₁ -Ar- y R₂ -A- siendo Ar un resto aromático de uno o varios núcleos, R₁ uno o varios restos de alquilo, restos sustituidos de alquilo, hidroxilo, halógeno, alcoxi, acilamino, sulfonilamino, formilo, ciano, carboxi, N-alquilcarboxilamida, N,N-dialquilcarboxilamida,
25. carbalcoxi; restos halógeno sustituidos de carbalcoxi, arilcarbonilo ó alquilomercapto, A significa un resto alifático ó cicloalifático saturado o sin saturar y R₂ significa uno ó varios átomos de halógeno, restos de hidroxilo, ciano, sulfonilamino, carboxi, N-alquilcarboxilamida, N,N-dialquilcarboxilamida, carbalcoxi, restos haló
- 30.



geno sustituidos de carbalcoxi, alquilcarbonilo, carboxi-
alquildisulfuro, carboxialquilmercapto, cianalquilmercap-
to ó arilmercapto; se calientan con paraformaldehido en
presencia de disolventes orgánicos miscibles en agua.

5. 2ª.- Procedimiento, según la reivindicación
1ª, caracterizado porque la temperatura de calentamiento,
está comprendida entre los 90 y 150°C.

10. 3ª.- Procedimiento, según la reivindicación
1ª, caracterizado porque como disolventes orgánicos se
emplean el glicol etilénico, dietilénico y propilénico,
así como monómeros de estos glicoles y los alcoholes in-
feriores, monovalentes tal como el alcohol etílico y pro-
pílico.

15. 4ª.- Procedimiento, según la reivindicación
1ª, caracterizado porque la proporción en que entra el
ácido carboxílico, es de una molécula-gramo por 0,5 has-
ta 3 moléculas-gramo de formaldehido.

20. 5ª.- "Procedimiento para la preparación de de-
rivados carboxílicos de efecto antimicrobial", tal y co-
mo queda substancialmente descrito en la presente memoria.

Esta memoria consta de ocho hojas escritas a
máquina por una sola cara.

Madrid, 18 DIC. 1935

FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,

GOMEZ ACEBO Y MODEI
p. Firmado: F. Hernández Ruiz