

27 JUL



405181

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

por VEINTE años

cuyo privilegio se solicita para España,
sus territorios y plazas de soberanía, a
favor de:

D^a. MARIA ANGELES JAUMOT BARRERA

de nacionalidad española, domiciliada en
Barcelona, calle Arco Iris, núm. 79 bis,
relativa a:

"PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN COM
PUESTO ANTIBACTERIANO"

=====

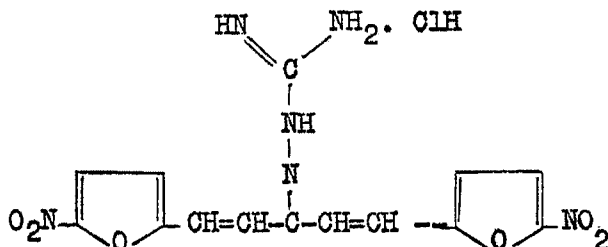
405181



Int. Cl.: C07D11A61K

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere, conforme se indica en su enunciado a un procedimiento para la obtención de un compuesto antibacteriano, específicamente el hidrocloruro de 1,5-bis(5-nitro-2-furil)-3-amino-guanidil-hidrazona-1,4-pentadieno, cuya fórmula de estructura es:



Este compuesto, además de su acción antibacteriana, como la mayoría de los nitrofuranos, es de gran predicamento en la avicultura por su efecto sobre la relación de conversión pienso/carne en los pollos, si se agrega a la dieta de estos en una proporción de 5 a 10 partes por millón. - - - - -

Hasta la fecha, la síntesis de este producto solamente se ha logrado a partir del 5-nitro-furfural-aldehído por doble condensación con una molécula de acetona y posterior reacción del intermedio resultante con una sal de guanidina para la formación de la correspondiente hidrazona. En toda la literatura que existe sobre la condensación entre el 5-nitro-furfural-aldehído y la acetona, se utiliza como medio condensante un medio fuertemente ácido constituido gene-

405181

27 JUL



5. ralmente por acético glacial-ácido sulfúrico, lo que obliga necesariamente a separar y purificar la acetona intermedia 1,5-bis-(5-nitro-2-furil)-1,4 pentadien-3-ona antes de ponerla en presencia de la sal de aminoguanidina, por ser el medio ácido fuerte incompatible con la subsiguiente formación de hidrazona. - - - - -

10. Para subsanar este inconveniente se ha investigado la consecución de un medio de condensación suave que evitará la parcial destrucción de la acetona intermedia y que permitiría, al mismo tiempo, la formación de la hidrazona sin necesidad de su separación. - - - - -

15. Como resultado de esta investigación se ha descubierto que utilizando como medio de condensación el metil cellosolve y como agente condensante el cloruro de zinc anhidro, se puede efectuar la condensación con altos rendimientos a partir de cantidades estequiométricas de nitrofurfural y acetona y que basta añadir la sal de aminoguanidina a la masa de reacción para obtener la amino-guanidilhidrazona, que se separa fácilmente precipitándola como clorhidrato. - - -

20. De acuerdo con las precedentes premisas se ha desarrollado un procedimiento que se caracteriza porque la síntesis del hidrocloreto de 1,5-bis(5-nitro-2-furil)-3-amino-guanidil-hidrazona-1,4-pentadieno se efectúa por condensación entre un mol de acetona y dos moles de 5-nitro-furfural-aldehído, utilizando como agente de condensación el cloruro de zinc anhidro en un solvente adecuado y en medio débilmente ácido, y seguidamente en el propio medio, sin nece-

25.

405181

27 J



sidad de separar el producto intermedio formado, se añade una sal de aminoguanidina, precipitándose finalmente el producto obtenido, en forma de clorhidrato, por adición de ácido clorhídrico. - - - - -

- 5. Con este procedimiento se logra directamente y en una sola operación un producto de gran pureza y con un elevado rendimiento, lo cual es muy interesante desde el punto de vista industrial. Es de observar la importancia que tiene el uso como agente condensante del cloruro de zinc anhidro, aplicación que se ha descubierto para este caso. - - -

- 10. Para facilitar la comprensión de las ideas expuestas, se describe seguidamente un ejemplo de realización de la invención, el cual, dado su carácter meramente ilustrativo, deberá ser considerado como desprovisto de toda limitación respecto al alcance de la protección legal que se solicita, - - - - -

EJEMPLO

- 20. A 95 litros de metilcellosolve se añaden 36 Kgs de 5-nitro-furfuraldehído y 7,3 Kgs de acetona. Inmediatamente se agregan 43,7 Kgs de cloruro de zinc anhidro y 5 Kgs de ácido sulfúrico concentrado. El conjunto se somete a agitación durante 10 horas a la temperatura de 94-96°C. - - - - -

- 25. Se agregan 13,5 Kgs de bicarbonato de aminoguanidina y a continuación, lentamente, en el transcurso de unas horas (aproximadamente 2 horas), 13,5 litros de ácido clorhi-

405181



27

drico concentrado, manteniendo siempre la temperatura a 90°C y utilizando una buena agitación. - - - - -

Se enfría y se filtra. Se obtienen 30 Kgs de 1,5-bis-(5-nitro-2-furil)-3-amino-guanidil-hidrazona-1,4-pentadieno como clorhidrato en forma de polvo amarillo-anaranjado, insoluble en agua y en la mayoría de los disolventes orgánicos. p.f. = 280-285°C (desc.). La cantidad obtenida representa un rendimiento del 51% del teórico. - - - - -

5.

10.

Descritas convenientemente las características de la invención, se hace constar que en la misma podrá introducirse cuantas variantes pueda aconsejar la experiencia siempre que con ello no se modifique la esencialidad de la misma que es la que se resume y concreta en la siguiente - - - -

N O T A

15.

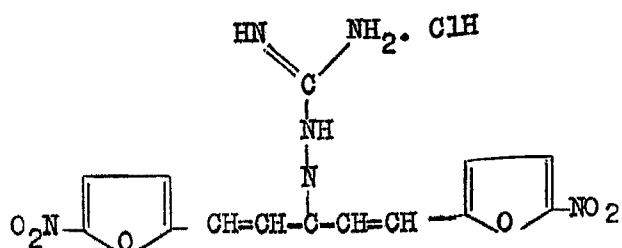
Se declaran de novedad y propiedad para España, sus territorios y plazas de soberanía, las siguientes: - - - - -

R E I V I N D I C A C I O N E S

20.

1.- Procedimiento para la obtención de un compuesto antibacteriano, específicamente el hidrocloreto de 1,5-bis(5-nitro-2-furil)-3-amino-guanidil-hidrazona-1,4-pentadieno, cuya fórmula estructural es:

Key



405181

27 JUL



caracterizado porque la síntesis de este compuesto se efectúa por condensación entre un mol de acetona y dos moles de 5-nitro-furfural-aldehído, utilizando como agente de condensación el cloruro de zinc anhidro en un solvente adecuado y en medio débilmente ácido y seguidamente en el propio medio, sin necesidad de separar el producto intermedio formado, se añade una sal de aminoguanidina, precipitándose finalmente el producto obtenido, en forma de clorhidrato, por adición de ácido clorhídrico. - - - - -

5.

10.

2.- Procedimiento para la obtención de un compuesto antibacteriano, según la reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente utilizado como medio de condensación es el metilcellosolve. - - - - -

15.

3.- Procedimiento para la obtención de un compuesto antibacteriano, según la reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente utilizado como medio de condensación es un compuesto con funciones éter y alcohol, tal como el etilenglicol y similares. - - - - -

20.

4.- "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE UN COMPUESTO ANTIBACTERIANO". - - - - -

Todo ello conforme se describe y reivindica en la presente memoria que consta de seis hojas, foliadas y mecanografiadas por una sola de sus caras.

12g

MADRID, 27 JUL. 1972

P. A. M. CURELL SUÑOL

M. Curell Suñol

mts.