



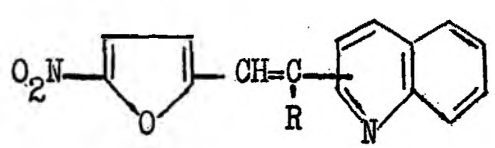
13 AB

276 447

MEMORIA DESCRIPTIVA
de una Patente de Invención a nombre de:
C.F. BOEHRINGER & SOEHNE G.m.b.H., de nacionalidad alemana, domiciliada en MANNHEIM-WALDHOF (Alemania); por: "PROCEDIMIENTO PARA LA FABRICACION DE NUEVOS DERIVADOS DE 5-NITROFURANO".

-----ooo000ooo-----

Los derivados de 5-nitrofurano de la fórmula general



5 en la que R es hidrógeno o un resto alquilo, no han sido descritos hasta ahora en la bibliografía. Se descubrió que estos compuestos poseen excelente propiedades bacteriostáticas; en comparación con los derivados de nitrofurano conocidos, se tiene sobre todo una mejor eficacia frente a staphylococcus



276447

aureus, escherichia coli y streptococcus aureus.

10 La fabricación de los nuevos derivados de 5-nitrofurano
se hace según métodos ya conocidos, de preferencia por conden-
sación de 5-nitrofurfurol con alquil-quinoleinas. Pero a la
inversa de esta reacción, también pueden condensarse los co-
rrespondientes quinolein-aldehidos o quinolein-cetonas con
15 5-nitro-2-metil-furano. En estas condensaciones es también po-
sible, además, introducir derivados metal-orgánicos, por ejem-
plo haciendo reaccionar 5-nitrofurfurol con halogenuro de quino-
lil-alquil-magnesio o, a la inversa, aldehidos o cetonas de
quinoleina con compuestos Grignard de 5-nitro-2-halogenmetil-
20 furanos, y deshidratarlos seguidamente.

Los nuevos nitrofuril-quinolil-etilenos pueden tras-
pasarse de forma en sí conocida a sus sales amónicas cuaterna-
rias, o a los óxidos N.

EJEMPLO 1

25 2,86 g de quinaldina y 4 g de anhídrido acético se
calientan con 2,82 g de 5-nitrofurfurol durante 2 horas hasta
130°C. Después del enfriamiento se neutraliza el preparado con
bicarbonato sódico acuoso, se le aspira para separarlo de la
parte no disuelta, y se lava bien con agua. El residuo (5,5 g)
30 se recristaliza a partir de isopropanol; se obtienen 2,4 g de
1-(5-nitro-2-furil)-2-(2-quinolil)-etileno del punto de fusión
176-180°, que después de la cristalización subsiguiente funden



276447

a 181-182°.

Si una solución de cloroformo de la combinación de etileno se hace reaccionar a temperatura ambiente con ácido perbenzoico, se obtiene el óxido N del 1-(5-nitro-2-furil)-2-(2-quinolil)-etileno del punto de fusión 211-212°C.

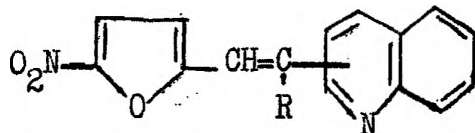
EJEMPLO 2

11,4 g de lepidina y 11,25 g de 5-nitrofurfurol se hacen reaccionar de forma análoga a lo explicado en el ejemplo 1 para el correspondiente compuesto α. Se obtienen 9,3 g de 1-(5-nitro-2-furil)-2-(4-quinolil)-etileno del punto de fusión 152-153°C (a partir de dioxano).

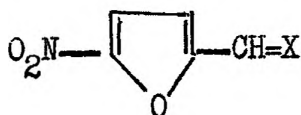
-----NOTA-----

Se reivindica como nuevo y de propia invención:

1.- Procedimiento para la fabricación de nuevos derivados de 5-nitrofurano, caracterizado porque partiendo de la fórmula general



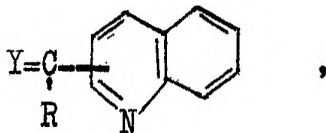
en la que R es hidrógeno o un resto alquilo, así como de sus sales amónicas cuaternarias y óxidos N, a compuestos de 5-nitrofurano de la fórmula



276447



se los condensa con derivados de piridina de la fórmula



60 en la que R. tiene el significado anterior y uno de ambos res-
tos X e Y significa un átomo de oxígeno, mientras que el otro
representa hidrógeno o un grupo metalorgánico, y después, si
interesa, se traspasan los compuestos obtenidos, como de cos-
tumbre, a sus sales amónicas cuaternarias o a los óxidos N.

65 2.- PROCEDIMIENTO PARA LA FABRICACION DE NUEVOS DE-
RIVADOS DE 5-NITROFURANO.

Tal como se describe y reivindica en la presente Me-
moria Descriptiva, que consta de cuatro hojas escritas a má-
quina por una sola cara.

Madrid, 13 ABR. 1962

CARLOS FERRAZ DELAS
P. P.