



281455

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de una

.....
PATENTE DE INVENCION

por VEINTE años en España, por "METODO PARA PREPA-
RAR UN COMPUESTO PARASITICIDA"

.....
.....
.....
a favor de

THE NORWICH PHARMACAL COMPANY

domiciliado en 17 Eaton Avenue, NORWICH, New York,

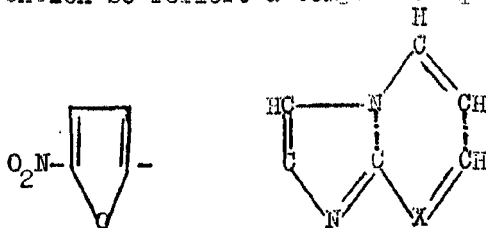
EE. UU.

PRIORIDAD : de la solicitud de patente estadounidense
Nº. 144.305 del 11 de octubre de 1961.

INVENTOR : Peter Hsing Lee Wei, de nacionalidad es-
tadounidense.



La invención se refiere a compuestos químicos de fórmula:



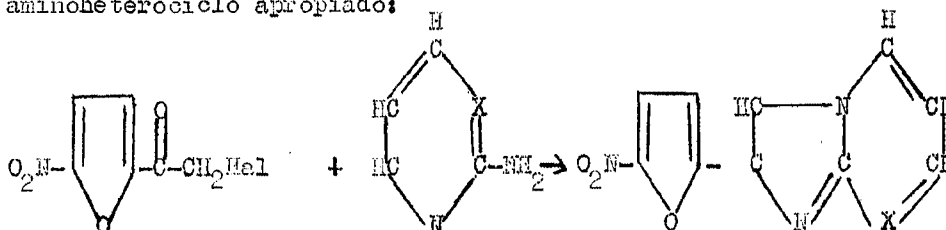
5

en la cual X representa nitrógeno o formileno. Estos compuestos son sólidos cristalinos de baja solubilidad en el agua y de punto de fusión alto. Son parasiticidas particularmente contrarios a las bacterias y protozoos. Pueden combinarse fácilmente con vehículos apropiados administrándose convenientemente para combatir y evitar el crecimiento de parásitos. En combinación con vehículos farmacéuticos adecuados estos compuestos ejercen una acción antimicrobiana mediante administración oral. De esta manera se han protegido ratones mortalmente infectados con *Salmonella typhosa* administrándoles desde alrededor de 50 a 250 mg./kg de estos nuevos compuestos. Además, se han tratado con éxito pollos y pavos infectados de *Histomonas meleagridis* mediante la administración de alimentos que contienen desde alrededor de 0,011% a 0,022% en peso de estos compuestos. Los compuestos se preparan fácilmente haciendo reaccionar un halometilo 5-nitro-2-fenil cetona con el aminoheterociclo apropiado:

10

15

20



25

en cuya fórmula X tiene el significado dado anteriormente. La reacción se lleva a cabo preferiblemente en presencia de un solvente inerte tal como dimetilformamida o alcohol empleando cantidades equimolares de los reactivos. La reacción tiene lugar uniformemente a temperatura ambiente o ligeramente elevada y el producto final se recupera fácilmente de manera convencional.

30

281455



Al llevar a cabo la reacción, el halometil 5-nitro-2-furil cetona, preferiblemente bromometil 5-nitro-2-furil cetona, se disuelve en un solvente inerte tal como dimetilformamida o alcohol y se añade al aminoheterociclo disuelto o suspendido en un solvente semejante. Es conveniente agitar la mezcla para asegurar un buen contacto de los reactivos. La reacción se efectúa fácilmente a temperatura ambiente aunque puede suministrarse calor, si se desea, para facilitarla. Después de la terminación de la reacción, indicada por la aparición de cristales; se filtra la mezcla. Antes del filtrado, la solución puede tratarse con un agente clarificador tal como carbón vegetal y el producto final se recupera del filtrado mediante enfriamiento y filtración. El producto puede purificarse recristalizándolo a partir de solventes adecuados tales como dimetilformamida o nitrometano.

Con objeto de que la invención pueda ser fácilmente entendida por los expertos en el arte, se incluyen los siguientes ejemplos:

EJEMPLO I

2-(5-Nitro-2-furil) imidazo [1,2-a] piridina.

A una solución de 66 g. de 2-aminopiridina en 300 cc. de etanol se añade una solución de 82 g. de bromometilo 5-nitro-2-furil cetano en 70 cc. de dimetilformamida. La solución oscura se calienta sobre una placa caliente hasta que aparecen los sólidos. Después de enfriar los sólidos amarillos se recogen y lavan en etanol y eter. Se obtienen 51 g. (63,8% de producción) de 2-(5-nitro-2-furil) imidazo [1,2-a] piridina que pueden recristalizarse a partir de nitrometano para dar el producto (p.f. 252°-254°C.).

Anal. para $C_{11}H_7N_3O_3$: Calc. C. 57,64; H. 3,08; N. 18,34; Recuperado: C 57,60 57,62; H. 3,48 3,40; N. 18,49 18,61.

EJEMPLO II

2-(5-Nitro-2-furil) imidaza [1,2-a] pirimidina

Una solución de 70 g. de brometil 5-nitro-2-furil cetona en ---

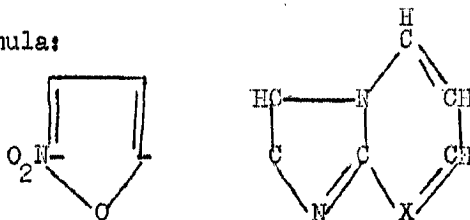


100 cc. de dimetilformamida se añade a una suspensión de 60 g. de 2-amino-pirimidina en 250 cc. de dimetilformamida. La solución oscura se trata con carbón vegetal y se filtra. El filtrado se calienta sobre una placa caliente durante 10 minutos. Después de enfriarse se recogen los sólidos de color pardo. La recristalización a partir de dimetilformamida de 42 g. de 2-(5-nitro-2-furil) imidazo [1,2-a] pirimidina amarilla cristalina (producción 61%), que se descompone por encima de los 300°C.

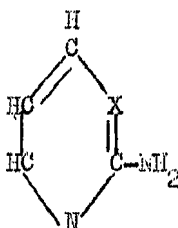
Anal. para $C_{10}H_6N_4O_3$: Calc. C. 52,18; H. 2,63; N. 24,34; Recuperado: C. 51,97, 51,84; H. 2,72, 2,61; N. 24,45, 24,56.

REIVINDICACIONES

1. Método para preparar un compuesto parasiticida, correspondiente a la fórmula:



en la que X representa un miembro del grupo consistente en nitrógeno y formileno cuyo método comprende poner en contacto un halometil 5-nitro-2-furil cetona y un aminoheterociclo representado por la fórmula:



en la que X tiene la significación anterior, en la presencia de un solvente inerte.

2. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la Patente de Invención que se solicita: "MÉTODO PARA PREPARAR UN COMPUESTO PARASITICIDA".

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente me-

281455



moria descriptiva que consta de cinco páginas mecanografiadas por una sola cara.

Madrid, 10 octubre 1962

ALFONSO URGALIA

P.P.

5

10

15

20

25

30