

31 0983



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

por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVAS UREAS SUBSTITUI-
DAS", a favor de la razón social suiza J.R. GIGY, A.G.,
residente en BASILEA (Suiza).

= . =

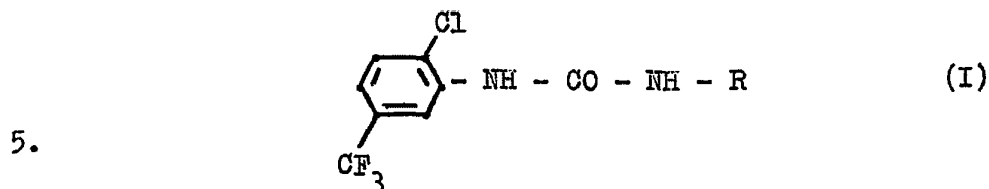
MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un nuevo pro-
cedimiento para la preparación de ureas sustituidas con pro-
piedades valiosas farmacológicamente.

Se ha hallado, que las ureas sustituidas, hasta
5. ahora no conocidas, de la fórmula general I,



310983



en la que

10. R significa un radical alquílico inferior, en especial el radical metílico o etílico,

poseen actividad ventajosamente analgésica, así como también antiflogística, antipirética, sedativa y potencial anestésico.

15. Se obtienen los compuestos de la fórmula general I al hacer reaccionar en isocianato 2-cloro-5-trifluorometil-fenílico o un derivado funcional del ácido 2-cloro-5-trifluorometil-carbámico, capaz de reacción y transformable en ese en caliente, en especial la amida, la N,N-difenil-amida o el cloruro, con una N-alquilamida del ácido alcohólico, en especial con una N-alquil-formamida o N-alquil-acetamida inferior y la N-(2-cloro-5-trifluorometil-fenil)-N'-alquil-N'-alcanoil-urea obtenida en primer lugar se hidroliza para llegar a la urea N,N'-bisustituída de
- 20.
25. la fórmula general I. La hidrólisis se puede efectuar en caliente, por ejemplo mediante ácidos o lejías acuosos.

310983



El ejemplo siguiente explica más de cerca la preparación de los nuevos compuestos de la fórmula general I, sin limitar en ninguna forma la extensión de la invención. Las temperaturas se indican en grados Celsius.

5. EJEMPLO.

233 g de 2-cloro-5-trifluormetil-urea se suspenden en 250 g de metil-acetamida y se calienta durante 15 horas a 200°. Luego se destila en vacío la mayor parte de la metil-acetamida en exceso. El residuo oleoso se fija en 500 cc de metanol y esta solución se calienta a 40-50° durante 1 hora con 250 cc de lejía de sosa 4-n.

La mayor parte del metanol se evapora luego bajo vacío, con lo que precipita la N-(2-cloro-5-trifluormetil-fenil)-N'-metil-urea, formada. Se filtra, se lava con agua y recristaliza en metanol; punto de fusión 143-144°.

En forma análoga se prepara la N-(2-cloro-5-trifluormetil-fenil)-N'-etil-urea, punto de fusión 189-190°.

= . =

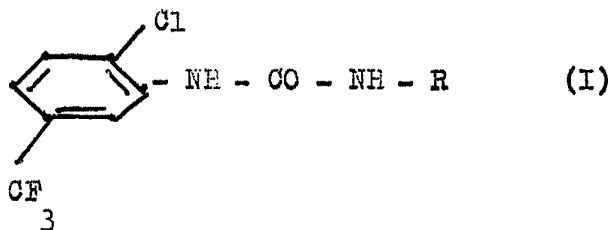


3 1 0 9 8 3

N O T A

Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas y de propia invención, las siguientes reivindicaciones con prioridad de la solicitud de patente suiza nº 3977/64 de 26 de Marzo de 1964.

- 5. 1. Procedimiento para la preparación de nuevas ureas substituidas de la fórmula general I,



10.

en la que

R significa un radical alquílico inferior, caracterizado porque el isocianato 2-cloro-5-trifluorometil-fenílico o un derivado funcional del ácido 2-cloro-5-

- 15. -trifluorometil-fenilcarbámico capaz de reacción, convertible por este ácido en caliente, se hace reaccionar con una N-alquil-amida inferior de ácido alcánico y la N-(2-cloro-5-trifluorometil-fenil)-N'-alquil-N'-alcancil-urea obtenida en primer lugar se hidroliza para llegar a la urea N,N'-disubstituida correspondiente de la fórmula general I.
- 20.



310983

2. Procedimiento para la preparación de nuevas ureas substituidas.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 5 hojas foliadas y escritas a

5. máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 25 MAR 1965

J. R. BEIGY, A.G.

p.a.

JAIME ISERN

p. p.