



30 SEP.

318337

318337

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

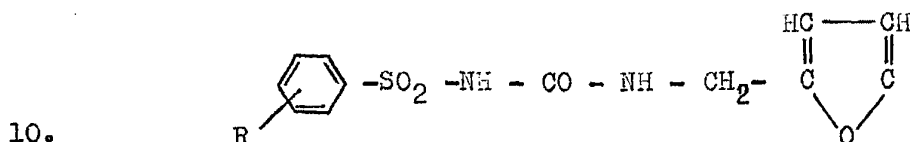
a favor de Don Juan BLADÉ PIQUÉ, de nacionalidad española, residente en Barcelona, calle Vallirana, 7, por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCIÓN DE NUEVOS DERIVADOS DE LA FURFURILAMINA".

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se refiere a un procedimiento para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina, los cuales poseen notable actividad hipoglucemiante y, por tanto, aplicación terapéutica.

- 5. El procedimiento objeto de la invención, para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina, especialmente arilsulfonilureas de fórmula



318337

30 SEP.



- donde R representa un radical alquílico de uno, dos o tres átomos de carbono, un halógeno, un radical acilo de dos o tres átomos de carbono, un radical acetilamino, un radical amino, un radical trifluormetilo o un radical metiltio, se
5. caracteriza esencialmente por el hecho de hacer reaccionar furfurilamina con derivados de sulfonilo, obteniéndose arilsulfonilureas y arilsulfoniltioureas, estas últimas son oxidadas con peróxido de hidrógeno en medio alcalino a arilsulfonilureas.
10. Los derivados de sulfonilo empleados son, de preferencia, arilsulfonilisocianatos, arilsulfonilcarbamatos, cloruros de arilsulfonilcarbamilo, y arilsulfonilisocianatos.
- También puede llevarse a cabo el procedimiento
15. con análogos resultados por tratamiento de la furfurilamina con fosgeno, con producción del isocianato correspondiente, el cual se hace reaccionar con una arilsulfamida obteniéndose la sulfanilurea.
- Para la obtención de sales de las substancias
20. mencionadas, la invención trata las mismas con productos alcalinos, tales como hidróxidos, carbonatos y bicarbonatos alcalinos y alcalinotérreos, y con bases orgánicas fisiológicamente tolerables.
- Para una mejor comprensión de cuanto se ha descrito se acompaña los siguientes ejemplos, de alcance meramente ilustrativo y no limitativo del objeto de la presente
25. invención.

E J E M P L O I .-

318337

20 SEP



- 10,5476 g de p-clorobencenosulfonilcarbamato de etilo (obtenido por reacción de la p-clorobencenosulfonamida con cloroformiato de etilo), y 4,2732 g de furfurilamina se hierven a reflujo durante tres horas disueltos en 200 ml de tolueno. Enfriando la mezcla de reacción precipita N₁-p-clorobencenosulfonil-N₂-furfuril-urea. Se recrystaliza en NaOH-CH₃COOH obteniéndose 10,2017 g de punto de fusión 170-171°C.
- 5.

E J E M P L O II.-

10. 10,8516 g de p-acetilbencenosulfonilcarbamato de etilo, (obtenido por diazoación de la p-aminoacetofenona y reducción con SO₂ en medio acético, tratamiento con amoniaco del sulfocloruro resultante y reacción de la sulfamida con cloroformiato de etilo), se tratan con 4,2732 g de furfurilamina disueltos en 200 ml de tolueno, a reflujo durante tres horas. Por recrystalización en NaOH-ClH se obtiene 9,1235 g de N₁-p-acetilbencenosulfonil-N₂-furfuril-urea, de punto de fusión 138-140°C.
- 15.

E J E M P L O III.-

20. 11,4253 g de p-acetilaminobencenosulfonilcarbamato de etilo, (obtenido por clorosulfonación de la p-aminoacetanilida, tratamiento del sulfocloruro resultante con amoniaco y reacción de la sulfamida correspondiente con cloroformiato de etilo), y 4,2732 g de furfurilamina, se disuelven en 200 ml de tolueno y se hierven a reflujo durante tres horas. Recrystalizando en dimetilformamida-agua se obtienen 7,3075 g de N₁-p-acetilbencenosulfonil-N₂-furfuril-urea, de punto de fusión 213-214°C.
- 25.

318337



E J E M P L O IV.-

5. 3 g de N₁-p-acetilbencenosulfonil-N₂-furfuril-
-urea, obtenida según el ejemplo anterior, se tratan du-
rante dos horas con 30 ml de KOH 2N a reflujo. Por recris-
talización en dimetilformamida-éter, se obtiene 2,1265 g
de N₁-p-aminobencenosulfonil-N₂-furfuril-urea de punto
de fusión 222-223°C.

E J E M P L O V.-

10. 11,0139 g de p-metiltiobencenosulfonilcarbama-
to de etilo (obtenido por clorosulfonación del tianisol,
tratamiento con amoniaco del sulfocloruro resultante y
reacción de la sulfamida con cloroformiato de etilo), y
4.2732 g de forfurilamina, se disuelven en 200 ml de to-
lueno y se tratan tres horas a reflujo. Después de enfriar
15. y recristalizar el precipitado en NaCH-ClH, se obtiene
4,2482 g de N₁-p-metiltiobencenosulfonil-N₂-furfuril-urea
de punto de fusión 143-144°C.

20. Serán independientes del alcance de la presente
invención los detalles y características no esenciales de
los productos reaccionantes, aparatos y utillaje empleados
y, en general, cuantos detalles accesorios puedan presen-
tarse, siempre que no alteren el espíritu de las siguien-
tes reivindicaciones.

318337

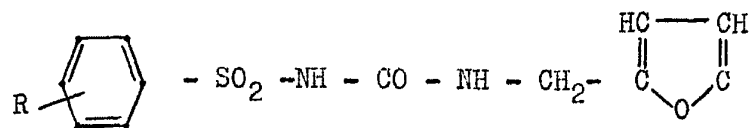


N O T A

Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

1. Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina, especialmente arilsulfonilureas de fórmula

5.



10.

donde R representa un radical alquílico de uno, dos o tres átomos de carbono, un halógeno, un radical acilo de dos o tres átomos de carbono, un radical acetilamino, un radical amino, un radical trifluormetilo o un radical metiltio,

15.

caracterizado esencialmente por el hecho de hacer reaccionar furfurilamina con derivados de sulfonilo, obteniéndose arilsulfonilureas y arilsulfoniltiureas, siendo estas últimas oxidadas con peróxido de hidrógeno en medio alcalino a arilsulfonilureas.

20.

2. Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina, según la reivindicación anterior, caracterizado por el hecho de emplear, de preferencia como derivados de sulfonilo, arilsulfonilisocianatos, arilsulfonilcabamatos, cloruros de arilsulfonilcarbamilo, y arilsulfonilisotiocianatos.

25.

3. Procedimiento para la obtención de nuevos de-

318337



5. rivados de la furfurilamina, según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de tratar la furfurilamina con forgeno, con producción del insocianato correspondiente, el cual se hace reaccionar con una arilsulfamida obteniéndose la sulfanilurea.

10. 4. Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina, según las reivindicaciones 1 2 y 3, caracterizado por el hecho de obtener sales de las substancias mencionadas por tratamiento de las mismas con productos alcalinos, tales como hidróxidos, carbonatos y bicarbonatos alcalinos y alcalinotérreos, y con bases orgánicas fisiológicamente tolerables.

5. Procedimiento para la obtención de nuevos derivados de la furfurilamina.

15. La presente memoria consta de seis hojas foliadas escritas a máquina por una sola cara.

Barcelona, 30 de septiembre de 1.965

Juan BLADÉ PIQUÉ

p.a.