



33 03 16

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

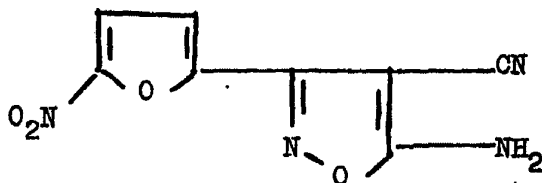
por "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE UN NUEVO 5-NITRO-2-FURIL-ISOXAZOL", a favor de la firma suiza J.R. GEIGY A.-G., domiciliada en BASILEA (Suiza).

- . -

MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a un procedimiento para la preparación de un 5-nitro-2-furil-isoxazol farmacológicamente activo, de la fórmula

5.

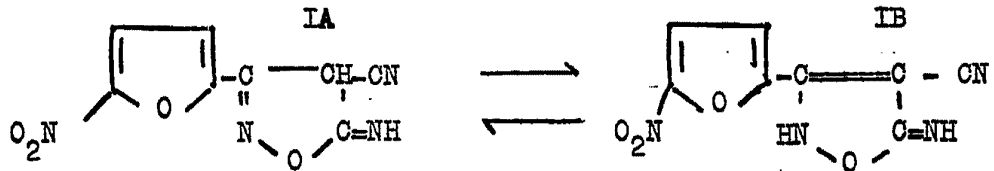


(I)



Para la preparación del 5-nitro-2-furil-isoxazol de la fórmula I se deshidrata compuesto de 3-(5'-nitrofuril-2')-4-carbamoil-5-aminoisoxazol. La deshidratación se efectúa, por ejemplo, mediante calentamiento a temperaturas elevadas, de preferencia a temperatura que se halle entre 50° y el punto de ebullición de la mezcla reaccional (en reflujo). Se recomienda emplear en el procedimiento un agente de los usuales para la deshidratación de compuestos de carbamoilo a fin de convertirlos en los correspondientes nitrilos; por ejemplo, oxicloloruro de fósforo.

Aunque el compuesto según este invento se transcriba por la fórmula I indicada antes, se le puede representar también por una de las fórmulas tautómeras IA o IB que siguen, o por ambas:



Sin embargo, por motivos de claridad, se adopta en esta solicitud la fórmula I, y ésta en consecuencia se describirá como derivado de nitrofuril-isoxazol y se aplicará a base del ejemplo.

El compuesto de este invento posee provechosas propiedades farmacológicas, y en particular antimicrobianas, y constituye un valioso agente antibacteriano, fungicida, antiviral, antihelmíntico, coccidicida o pro-



motor del crecimiento para uso externo o interno en la Medicina humana y en la veterinaria.

5. En los ensayos, el compuesto preparado según el procedimiento que se ha descrito demuestra sobresaliente acción antimicrobiana, y en particular acción antibacteriana. En los organismos vivos es eficaz, por ejemplo, contra las infecciones generales por estafilococos y contra las infecciones ocasionadas por microorganismos de los tipos *Salmonella* y *Escherichia coli*.
10. El compuesto así preparado se ha revelado un agente bacteriostático eficaz contra el *Staphylococcus aureus*, el *Escherichia coli* y el *Mycobacterium tuberculosis* (razas resistentes a la isonicotinoilhidracida y a la estreptomina).
15. Sumamente valiosos resulta este compuesto en el tratamiento de infecciones del tracto intestinal o del tracto urinario. Puede servir además para la protección de materias orgánicas expuestas a la descomposición por bacterias, hongos u otros microbios, para lo cual estas materias se juntan con el compuesto, se impregnan con él o se tratan con él de algún otro modo.
20. Conforme al invento se obtiene también una composición de materia que consta de una proporción de eficacia antimicrobiana del 3-(5'-nitrofuril-2')-4-carbamoil-
25. -5-aminoisoxazol de la fórmula I y de un vehículo sólido o diluyente líquido aceptables farmacológicamente.



- Por último, el invento comprende también un procedimiento para la protección de materias orgánicas expuestas al ataque de las bacterias, los hongos u otros microbios, procedimiento que se caracteriza por tratarse
5. las materias con un 5-nitro-2-furil-isoxazol de la fórmula:
- I. La materia orgánica puede ser, por ejemplo, un material polimérico natural o sintético, una sustancia provista de proteínas o de hidratos de carbono o un material fibroso o textil, natural o sintético, hecho a base de dichas sustancias.
- 10.

El ejemplo que sigue tiene por objeto explicar más detalladamente el invento. Las temperaturas están indicadas en grados centígrados.

EJEMPLO

15. Se calienta a 100°, durante 2 horas, una mezcla de 15 g de 3-(5'-nitrofuril-2')-4-carbamoil-5-amino-isoxazol y 40 g de oxiclóruo de fósforo. Después del enfriamiento, se añaden a la mezcla, despacio y refrigerando, 100 cc de agua, se recoge el precipitado, se le lava con agua y se le recristaliza en una mezcla de agua y dimetilformamida.
- 20.

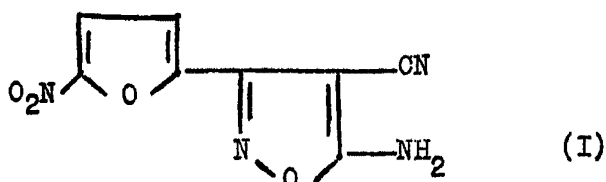
Se obtiene como producto final 3-(5'-nitrofuril-2')-4-ciano-5-amino-isoxazol, de punto de fusión 263° (descomposición).



N O T A

Descrito el objeto de la invención, se declara nuevas las siguientes reivindicaciones, con prioridad inglesa número 35 448/65 del 18 de Agosto de 1965:

1. Procedimiento para la preparación de un nuevo 5-nitro-2-furil-isoxazol, de la fórmula I



caracterizado por deshidratarse un 3-(5'-nitrofuril-2')-4-carbamoil-5-aminoisoxazol.

2. Procedimiento para la preparación de un nuevo 5-nitro-2-furil-isoxazol.

Según se describe y reivindica en la presente memoria que consta de 5 hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 17 de Agosto de 1966

15.

p.a.

JAME ISERN
R. P.

Firmado: JOSÉ RODRÍGUEZ