

358225

SECCION TECNICA

CLASIFICACION I. P. C.

CLASE C07

SUBCLASE C

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

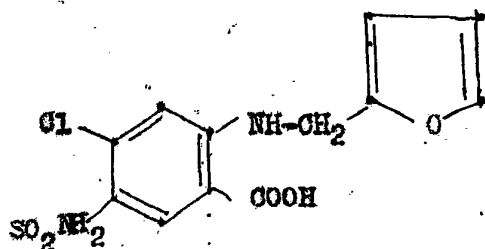
por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DEL ACIDO 4-cloro-N-(2 FURILMETIL)-5-SULFAMOIL ANTRANILICO Y DE SUS SALES", a favor de la firma italiana S.E.C.I., SOCIETA ELETTROTECNICA CHIMICA ITALIANA, S.p.A., residente en MILAN (Italia) Via G.B. Grassi 97 y D. Giuseppe BERNINI, de nacionalidad italiana, residente en MILAN (Italia), Via Don Gnocchi, 3.

* * *

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente invención se relaciona con un procedimiento para la obtención del ácido 4-cloro-N-(2-furilmetil)-5-sulfamoil antranílico, representado por la fórmula siguiente :

POOR
QUALITY



5.

El compuesto es interesante desde el punto de vista farmacológico por presentar una marcada actividad diurética.

La utilización terapéutica de esta sustancia puede hacerse en forma de ácido libre o en forma salificada con diversas bases.

10.

El modo de ejecución del presente invento consiste en el tratamiento del ácido 4-cloro-N,N-di-(2-furilmetil)-5-sulfamoyl anthranílico con hidrógeno en presencia de un agente catalítico como, por ejemplo, el níquel de Raney en dioxano.

15.

El ácido 4-cloro-N,N-di-(2-furilmetil)-5-sulfamoyl anthranílico puede obtenerse por el tratamiento del ácido 4-cloro-2-halogeno-5-sulfamoyl-benzoico con la di-(2-furilmetil)amina. La utilidad económica del empleo de la di-(2-furilmetil)-amina resulta evidente en cuanto este producto es un gasto de la producción de la 2-furilmetilamina.

20.

El presente invento se ilustra, pero no se limita, en el ejemplo siguiente :

EJEMPLO.-

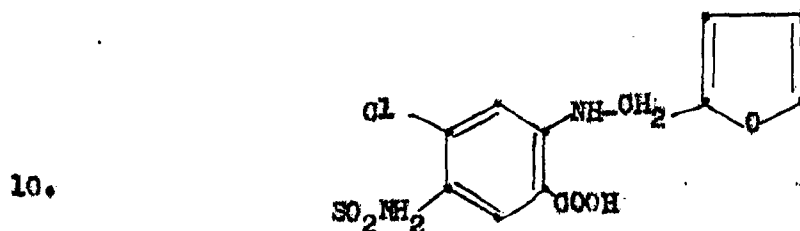
5. 3 g de éster metílico del ácido 2-fluoro-4-cloro-5-sulfamoi benzoico y 10 g de di-(2-furilmetil)-amina se calientan en baño de maría durante 3 horas. Se vierte el producto de reacción sobre 100 ml de agua y se neutraliza con ácido acético hasta un pH comprendido entre 5 y 6. El sólido precipitado se recoge por filtración, se lava con
10. agua y se seca. Se obtiene así el éster metílico del ácido 4-cloro-5-sulfamoi-N-N-di-(2-furilmetil) entranílico, de punto de fusión 141-143° C, en forma de polvo micro-cristalino de color crema, el cual se puede destinar a la operación siguiente :
15. Todo el producto obtenido anteriormente se calienta en baño de María con 100 ml de hidróxido sódico 2-n, hasta disolución. Se neutraliza esta mezcla por adición de ácido acético hasta un pH comprendido entre 4 y 5, y se recoge el ácido 4-cloro-5-sulfamoi-N-N-di-(2-furilmetil)
20. entranílico, de punto de fusión 124-126° C, el cual se puede destinar a la operación siguiente: Se disuelve este producto en 100 ml de dioxano, se agrega la solución a una suspensión de níquel de Raney en dioxano y se hidrogena durante 2 horas a presión atmosférica. Se filtra y

el filtrado transparente se destila hasta reducir el volumen inicial aproximadamente a 1/10. Se vierte sobre 50 ml de agua y se obtiene por filtración el ácido 4-cloro-5-sulfamoi1-N-(2 furilmetil) antranílico, de punto de fusión 206-207°C, el cual se puede destinar a su empleo terapéutico.

N O T A

Hecha la descripción del presente invento se declaran como nuevas y de propia invención las siguientes reivindicaciones :

5. 1.- Un procedimiento para la obtención del ácido 4-cloro-N-(2 furilmetil)-5-sulfamoil antranílico y sus sales de la fórmula



15. caracterizado esencialmente por el hecho de hacer reaccionar el éster metílico del ácido 4-cloro-2-halogeno-5-sulfamoilbenzoico con la di-(2-furilmetil)-amina, saponificar el éster del ácido 4-cloro-N-N-di-(2-furilmetil)5-sulfamoil antranílico así obtenido y reducir el ácido 4-cloro-N-N-di-(2-furilmetil)5-sulfamoil antranílico con hidrógeno, en presencia de un agente catalítico.

20. 2.- Un procedimiento según la reivindicación 1, en el cual se hace intervenir como agente catalítico el níquel de Raney.

3.- Procedimiento para la obtención del ácido 4-cloro-N-(2 furilmetil)-5-sulfamoiil antrenilico y de sus sales.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 6 hojas foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, a 7 de septiembre de 1968.

p.e.

JAIME ISERN

P. P.

Firmado: JAIME ISERN CUYAS