

384462

23



SECCION TECNICA	
CLASIFICACION I.P.C.	
CLASE <u>07</u>	<u>A61</u>
SUBCLASE <u>C</u>	<u>K</u>

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

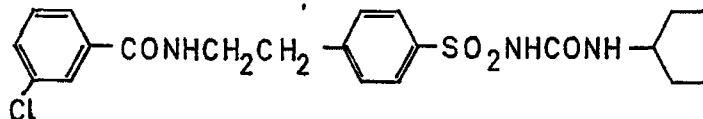
a favor de J. URIACH & CIA. S. A., entidad española, domiciliada en Barcelona, calle del Bruch, 49, por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCIÓN DE N-[4-(beta-(3-CLORO-BENZAMIDO)-ETIL)-BENCENOSULFONIL]-N'-CICLOPENTILCARBAMIDA".

---

MEMORIA DESCRIPTIVA

El objeto de la presente invención es un procedimiento para la preparación de la N-[4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonil]-N'-ciclopentilcarbamida, de fórmula química

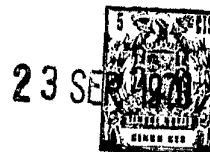
5.



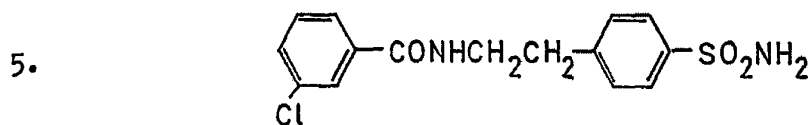
que presenta una profunda y prolongada actividad glucorreductora en sangre, ya sea en la forma indicada o en forma de alguna de sus sales.

10.

384462



El procedimiento consiste en hacer reaccionar la 4-(beta-(3-clorobenzamido)-etil)-bencenosulfonamida, de fórmula



con cloroformiato de etilo y ciclopentilamina, dentro de amplios límites de condiciones de reacción.

10. Ejemplo:

N-[4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonil]-N'-ciclopentilcarbamida.

15. Se suspenden 47,8 g de 4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonamida y 19,3 g de carbonato potásico anhidro finalmente pulverizado en 1000 ml de dioxano anhidro. La mezcla se calienta a 80°C y seguidamente se añaden 30,4 g de cloroformiato de etilo gota a gota. Se mantiene dicha temperatura durante 12 horas y, transcurrido este tiempo, se añade una disolución de 13,1 g de ciclopentilamina y 10 g de ácido acético en 10 ml de dioxano. La mezcla reaccionante se calienta a reflujo durante dos horas, después de lo cual se evapora el dioxano a presión reducida, se disuelve el residuo en una disolución de hidróxido amónico al 1% y se separa por filtración la parte insoluble, constituida por una pequeña cantidad
20. de 4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonamida intrans-
25. formada.

La disolución amoniacal se clarifica con carbón activo y se le añade ácido clorhídrico concentrado hasta pH fran-



camente ácido, con lo que precipita la N-[4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonil]-N'-ciclopentilcarbamida bruta. El producto se recristaliza en etanol absoluto. Punto de fusión 198-201°C.

- 5. Serán independientes del objeto de la invención los aparatos utilizados para la puesta en práctica del proceso descrito, aplicaciones ulteriores del producto obtenido, y, en general, todos cuantos detalles accesorios puedan presentarse, siempre que no aparten al conjunto de su esencialidad.

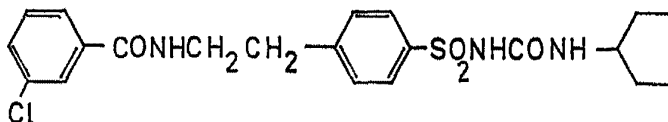
- . -

N O T A

- 10. Se reivindica como objeto de la presente patente de invención:

- 1. Procedimiento para la obtención de N-[4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonil]-N'-ciclopentilcarbamida, de fórmula química

- 15.



o de sus sales, que consiste en hacer reaccionar la 4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonamida con cloroformiato de etilo y ciclopentilamina en el seno de un medio inerte.

- 20.

- 2. Procedimiento para la obtención de la N-[4-(beta-(3-cloro-benzamido)-etil)-bencenosulfonil]-N'-ciclopentilcarbamida.

384462 238



Todo ello según queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de cuatro hojas foliadas escritas a máquina por una sola cara.

Barcelona, 22 de septiembre de 1970

J. URIACH & CIA. S. A.

p.a.