

MINISTERIO DE INDUSTRIA
REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL



10 ES	11 NUMERO - 455.600	10 A1
	21	
	22 FECHA DE PRESENTACION 2 Febrero 1.977	

CONCEDIDA
PATENTE DE INVENCION

= 6 FEB. 1978

30 PRIORIDADES: 31 NUMERO 32 FECHA 33 PAIS		
Int. Cl. CO7D 405/04 // (CO7D 233:72, 307:02)		
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL CO7D/A61K	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
54 TITULO DE LA INVENCION "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION de 1--/(5-(P-NITROFENIL)FURFURILIDEN) AMINO ₇ HIDANTOINA Y SU SAL SODICA"		
71 SOLICITANTE (S) LABORATORIO FARMACEUTICO QUIMICO-LAFARQUIM, S.A. DOMICILIO DEL SOLICITANTE Avda. de Aragón, 18 - Madrid-27		
72 INVENTOR (ES) 1) Dr. Miguel Izquierdo Sanjosé 2) Dr. Ulpiano Martín-Escudero Pérez Han cedido sus derechos a la solicitante.		
73 TITULAR (ES) La misma solicitante		
74 REPRESENTANTE D. Pablo Agudo Obregón		

" PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE 1- [5-(P-NITROFENIL)FURFU
RILIDEN)AMINO] HIDANTOINA Y SU SAL SODICA".

Memoria descriptiva

1 - [5-(p-nitrofenil)furfuriliden)amino]hidan-
toina sal sódica es un miorrelajante de acción directa sobre
la musculatura estriada, en el punto de unión mioneuronal por
interferencia con el transporte intracelular transmembrana
5 de los iones de calcio en la miofibrilla, que ha demostrado
ser eficaz en la terapia de diversos sindromas de mioespa-
sticidad tales como parálisis cerebral, esclerosis múltiple,
accidentes cerebrovasculares y lesiones traumáticas medulares,
sobre todo en rehabilitación funcional.

10 El objeto de la presente invención es un método
de obtención del citado compuesto y su sal sódica.

A continuación se dan ejemplos a título ilustra-
tivo del proceso de obtención.

Ejemplo 1

15 20 g. de 5-(p-nitrofenil)-2-furaldehido finamente
pulverizados se suspenden con agitación en 500 ml. de metanol,
La suspensión se calienta a unos 60º C y se añaden 12 g. de
aminohidantoína disueltos en 60 ml. de agua destilada calien-
te a unos 60º C y después 5 ml. de ácido clorhídrico concen-
20 trado. Se mantiene la misma temperatura y agitación durante
2-3 horas.

Después de una noche en reposo el sólido se filtra a vacío, se escurre bien y se lava con metanol.

Se seca al aire y luego a vacío a 100° C

25

Se obtienen 25-27 g. PF: alrededor de 280° C.

Ejemplo 2

30

10 g. de 1 -[5-(p-nitrofenil)furfuriliden)amino] hidantoina, obtenido según el ejemplo 1, finamente pulverizados se suspenden en 100 ml. de metanol seco. Con buena agitación se añaden, a temperatura ambiente, 15,5 ml. de solución 2,25N de metóxido sódico en metanol, diluidos con metanol seco hasta 100 ml.

35

Se agita 4-5 horas. Después de una noche en reposo, el sólido se separa por filtración, se lava con metanol y se seca a vacío a unos 70° C.

Se obtienen 10 g. de sal sódica.

REIVINDICACIONES

40

1.) Procedimiento de obtención de 1 -[5-(p-nitrofenil)furfuriliden)amino] hidantoina y su sal sódica, caracterizado porque se hace reaccionar 5(p-nitrofenil)furaldehído y 1 - aminohidantoina en un disolvente adecuado a temperatura de 50-80° C., separando el 1-[5-(p-nitrofenil)furfuriliden)amino] hidantoina por filtración, y posterior tratamiento de este producto en el mismo disolvente con un derivado de sodio, obteniéndose como producto de reacción la correspondiente sal

45

m/e

sódica.

2). Procedimiento de obtención de 1-[(5-(p-nitrofenil) furfuriliden)amino] hidantoina y su sal sódica, según reivindicación 1, caracterizado porque el disolvente adecuado puede ser alcohol de bajo peso molecular ó preferentemente dimetilformamida.

3). Procedimiento de obtención de 1 - [(5-(p-nitrofenil) furfuriliden)amino] hidantoina y su sal sódica, según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque el derivado de sodio puede ser un alcóxido sódico ó hidruro sódico, sólidos, ó en solución ó suspensión.

4). " PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE 1 - [(5-(P-NITROFENIL)FURFURILIDEN)AMINO] HIDANTOINA Y SU SAL SODICA".

Esta memoria consta de 3 hojas foliadas y mecanografiadas por un solo lado de sus caras.

Madrid, 2 de Febrero de 1.977

