

MINISTERIO DE INDUSTRIA  
Registro de la Propiedad Industrial



ESPAÑA

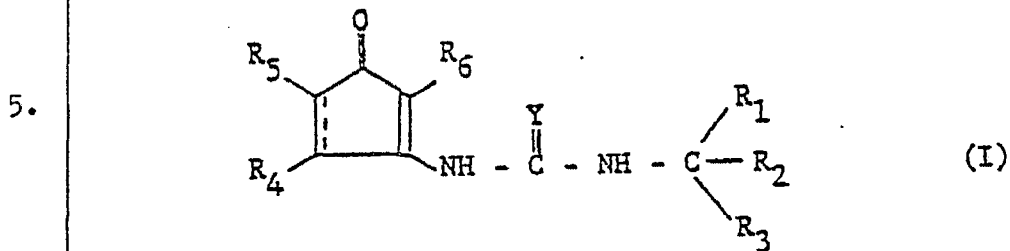
ENERGIA  
Se registra en el Registro de acuerdo  
con lo que figura en la pro-  
puesta de solicitud y según el con-  
tenido de la memoria adjunta.

19 ES	21	NUMERO	47982	20 AI
	22	FECHA DE PRESENTACION	23 ABR. 1978	

## PATENTE DE INVENCION

20 PRIORIDADES: 21 NUMERO	22 FECHA	23 PAIS
79504	24 de abril de 1978	Luxemburguesa
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
	C07C 127/17 // A61K 31/17	
24 TITULO DE LA INVENCION		
PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE 3-OXO-CICLOPENTENIL-UREAS.		
71 SOLICITANTE (S)		
CIBA-GEIGY AG		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE		
Klybeckstrasse 141, 4002 Basilea, Suiza.		
72 INVENTOR (ES)		
Hans Kühnis, Dr. Christian Egli, Dr. Kurt Eichenberger.		
73 TITULAR (ES)		
74 REPRESENTANTE		
Don José Miguel Gómez-Acebo Pombo.		

La invención se refiere a nuevas 3-oxo-ciclopentenil-  
ureas de fórmula



10. cuyo anillo ciclopentenílico puede llevar un ulterior enlace  
doble, y donde  $R_1$  significa hidrógeno o alquilo inferior,  $R_2$   
significa alquilo inferior y  $R_3$  significa alquilo inferior, en  
caso dado insaturado, o  $R_2$  y  $R_3$  junto con el átomo de carbono  
que los une, cicloalquilo, en caso dado insaturado, o  $R_1$ ,  $R_2$  y  
 $R_3$  junto con el átomo de carbono que los enlaza fenilo en caso  
15. dado sustituido,  $R_4$  significa hidrógeno, alquilo inferior o fe-  
nilo, en caso dado sustituido,  $R_5$  significa hidrógeno, un grupo  
carboxi o nitrilo, en caso dado esterificado o anidado, y  $R_6$   
significa hidrógeno o alquilo inferior, e Y está por oxígeno,  
azufre, el grupo imino =NH o el grupo ciancimino =N-CH, así  
20. como a procedimientos para su obtención, además, a preparados  
farmacéuticos conteniendo éstos compuestos y a su empleo, pre-  
ferentemente en forma de preparados farmacéuticos.

25. Los restos y compuestos designados en relación con  
la presente descripción "inferior" contienen preferentemente  
hasta 7 y, en primer lugar, hasta 4 átomos de carbono.

Un alquilo inferior, en caso dado insaturado, es pre-  
ferentemente un alquilo inferior, pero también alqueno inferior  
o alquino inferior.

30. Un ciclo-alquilo, en caso dado insaturado, es pre-  
ferentemente un cicloalquilo con 5-7 átomos de carbono de ani-

llo, por ejemplo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo, pero también un cicloalquenilo con 5-7 átomos de carbono de anillo, por ejemplo, ciclopentenilo, ciclohexenilo o cicloheptenilo, cuyo enlace doble se encuentra, en primer lugar, en la posición 1.

5. Un fenilo sustituido es, por ejemplo, un fenilo una, dos o también varias veces sustituido. Sustituyentes son, entre otros, alquilo inferior, alcoxi inferior, halógeno, trifluormetilo, alquilo inferior-sulfonilo o nitro.

10. Carboxi, en caso dado esterificado o amidado, es el mismo grupo carboxi, además, por ejemplo, alcoxi inferior-carbonilo, tal como metoxicarbonilo o fenil-alcoxi-inferior-carbonilo o carbamoilo, mono- o di-alquilo-inferior-carbonilo, en primer lugar, metil- o dimetil-carbamoilo.

15. El alquilo inferior es, por ejemplo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo o terc.-butilo y, en primer lugar, metilo o etilo.

El alquenilo inferior es, por ejemplo, vinilo, alilo, 2- o 3-metilalilo o 3,3-dimetilalilo.

El alquinilo inferior es, especialmente, propargilo.

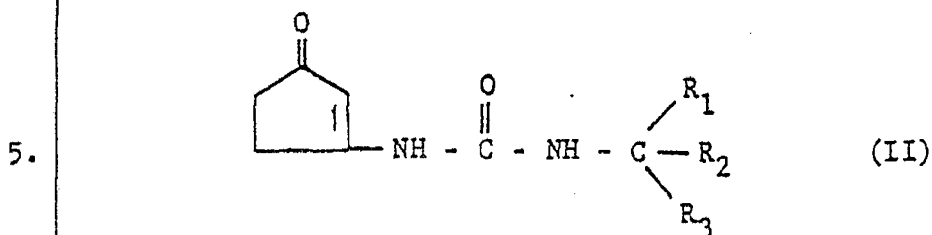
20. El alcoxi inferior es, por ejemplo, n-propiloxi, n-butiloxi, isopropiloxi o isobutiloxi y, en primer lugar, metoxi o etoxi.

El alquilo inferior-sulfonilo es, especialmente, metil-sulfonilo, etilsulfonilo o propilsulfonilo.

25. El halógeno es, preferentemente, el halógeno con el número atómico de 9 hasta 35, es decir, fluor, cloro o bromo.

Los nuevos compuestos poseen valiosas propiedades farmacológicas.

30. La invención se refiere especialmente a los compuestos de fórmula II



10. donde  $R_1$ ,  $R_2$  y  $R_3$  significan alquilo inferior, o donde  $R_1$  significa alquilo inferior y  $R_2$  y  $R_3$  junto con el átomo de carbono que los enlaza significan cicloalquilo con 5-7 átomos de carbono.

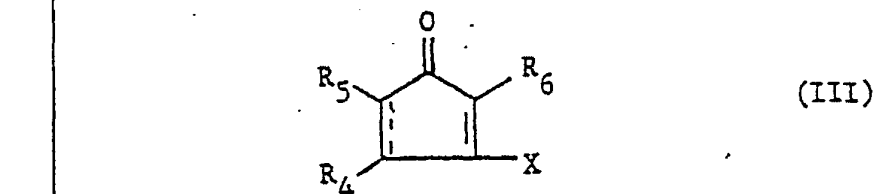
15. La invención se refiere ante todo a los compuestos de fórmula II, donde  $R_1$  y  $R_2$  significan metilo y  $R_3$  significa alquilo inferior con 1-3 átomos de carbono, o donde  $R_1$  significa metilo y  $R_2$  y  $R_3$  junto con el átomo de carbono que los enlaza significan cicloalquilo con 5-7, especialmente con 5 átomos de carbono.

20. En primer lugar se refiere la invención a los compuestos de fórmula (II), donde  $R_1$ ,  $R_2$  y  $R_3$  significan metilo.

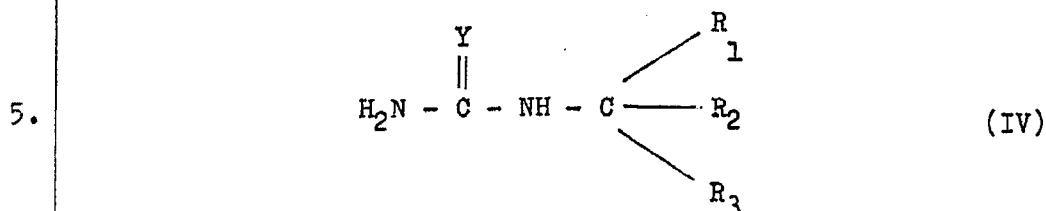
En especial se refiere la invención a los nuevos compuestos descritos en los ejemplos.

Los nuevos compuestos de fórmula I se pueden obtener según métodos en si conocidos.

25. Si se pueden obtener si un compuesto de fórmula III



donde X significa hidroxilo, en caso dado esterificado o eterado, se hace reaccionar con un compuesto de fórmula IV



10. Un hidroxilo en caso dado esterificado o eterado es, ante todo, hidroxilo que, bajo transposición del doble enlace en la posición 2,3 del resto ciclopentenilo, también se puede presentar como oxo. Hidroxilo esterificado es, en primer lugar, hidroxilo esterificado con ácidos inorgánicos u orgánicos fuertes, por ejemplo, hidrácido halogenado o ácido sulfúrico, o

15. ácido bencenosulfónico en caso dado sustituido por alquilo inferior, alcoxi inferior o halógeno, tal como ácido p-toluenosulfónico o ácido alcano inferior-sulfónico, tal como ácido metanolsulfónico. El hidroxilo eterado es especialmente el alcoxi inferior, tal como metoxi o etoxi.

20. La reacción se efectúa preferentemente bajo condiciones disociadoras de agua o bien de ácido. Así se hace reaccionar un compuesto de fórmula III, donde X significa hidroxilo, preferentemente en presencia de un ácido fuerte, tal como de un ácido sulfónico, por ejemplo, ácido p-toluenosulfónico o

25. ácido metanosulfónico. Aquí se trabaja preferentemente en un disolvente aprótico, tal como en un hidrocarburo aromático, por ejemplo, benceno, tolueno o xileno. Esta reacción se puede realizar también retirando en forma continua el agua que se forma durante la reacción, por ejemplo, por destilación. La

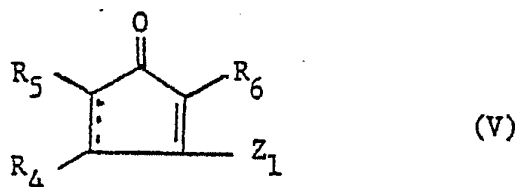
30. reacción con los compuestos de fórmula III, donde X significa

5. hidroxí esterificado o eterado se efectúa preferentemente en un disolvente, tal como en un alcohol, por ejemplo, metanol, etanol o propanol, di-alquilo inferior-formamida, por ejemplo, dimetilformamida o triamida del ácido hexametilfosfórico, si se desea, en presencia de una base, por ejemplo, alcoholato o hidruro alcalino o alcalino-térreo, una base de nitrógeno, tal como tri-alquilo inferior-amina, por ejemplo, trimetilamina, así como piridina o piperidina. Si se trabaja en un alcohol como disolvente se emplea como base, en primer lugar, el correspondiente alcoholato sódico o potásico, si se trabaja en 10. dimetilformamida se emplea como base, en primer lugar, un hidruro alcalino o alcalino-térreo, por ejemplo, hidruro sódico o potásico.

15. Los productos de partida a emplear para este procedimiento son conocidos o se pueden obtener en forma conocida, por ejemplo, por esterificación o eterización del compuesto de fórmula III, donde X significa hidroxí.

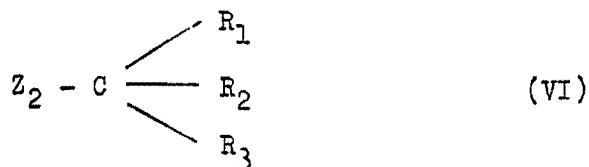
Los nuevos compuestos se obtienen también si un compuesto de fórmula

20.



25.

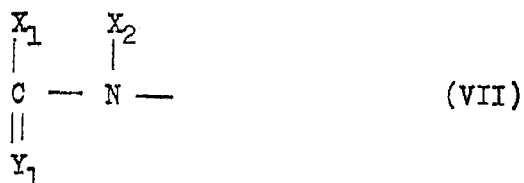
se hace reaccionar con un compuesto de fórmula VI



30.

donde uno de los restos  $Z_1$  y  $Z_2$  corresponde a un grupo amino y el otro al grupo de fórmula VII

5.



10. donde  $X_1$  significa hidroxilo o mercapto, en caso dado esterificado o eterado, capaz de reacción, y  $X_2$  significa hidrógeno, o  $X_1$  y  $X_2$  representan juntos un enlace entre C y N, e  $Y_1$  significa oxígeno, azufre, imino o cianimino, bajo la condición de que en caso de que  $Y_1$  signifique imino o cianimino,  $X_1$  representa halógeno y  $X_2$  hidrógeno.

15. Un grupo hidroxilo o mercapto esterificado, capaz de reacción,  $X_1$  es, especialmente, un grupo hidroxilo esterificado por un ácido inorgánico fuerte, especialmente un hidrácido halogenado, por ejemplo, ácido bromhídrico o clorhídrico. Un grupo hidroxilo o mercapto eterado, capaz de reacción es, en primer lugar alcoxi inferior, tal como metoxi o etoxi o alquilo inferior-mercapto, tal como metilmercapto.

20. Esta reacción se realiza preferentemente en un disolvente orgánico inerte, tal como benceno, dioxano, tolueno o xileno, a temperatura ambiente o temperatura moderadamente más elevada.

25. Los productos de partida son conocidos o se pueden obtener en forma conocida; así se puede obtener el ciclopenteno, por ejemplo, por disociación según Curtius del ácido 3-oxo-1-ciclopentencarboxílico.

30. En los compuestos obtenidos, donde Y significa el

grupo imino o el átomo de azufre, éste se puede transformar en el átomo de oxígeno, por ejemplo, mediante hidrólisis, preferentemente en presencia de un medio ácido, tal como de un ácido mineral, por ejemplo, ácido clorhídrico. Pero también se pueden

5. transformar los compuestos, donde Y significa azufre, por ejemplo, por reacción con un haluro de alquilo inferior en los correspondientes compuestos de alquilo inferior-mercapto y hacer reaccionar éstos, por ejemplo, con amoniaco o cianamida. Aquí se trabaja en ausencia o, preferentemente, en presencia de un

10. disolvente o diluyente y, si es necesario, bajo enfriamiento o calentamiento, por ejemplo, en un margen de temperaturas de unos 0°C hasta 150°C, en un recipiente cerrado y/o en una atmósfera de gas inerte.

El procedimiento comprende también aquellas formas de

15. ejecución donde los compuestos que se obtienen como productos intermedios son empleados como productos de partida y con éstos se realizan las etapas del procedimiento restantes, o el procedimiento se interrumpe en cualquier etapa; además, los productos de partida se pueden emplear en forma de derivados o ser forma-

20. dos durante la reacción.

Preferentemente se emplean aquellos productos de partida y se seleccionan las condiciones de reacción de manera que se obtengan los compuestos mencionados al principio como especialmente preferentes.

25. Los nuevos compuestos muestran un efecto reductor de la presión sanguínea, tal y como se puede demostrar en el ensayo con animales, por ejemplo, en administración i.v. en dosis de 1 hasta 30 mg/kg en el gato narcotizado, así como un efecto antihipertensivo, tal y como se puede mostrar en la rata renal-

30. hipertónica en dosis desde unos 10 hasta unos 100 mg/kg/día p.o.

Son menos tóxicos que los compuestos conocidos comparables. Los nuevos compuestos se pueden emplear, por lo tanto, como medios reductores de la presión sanguínea y como antihipertensivos.

- Los nuevos compuestos de la presente invención se pueden emplear, por ejemplo, para la obtención de preparados farmacéuticos que contengan una cantidad eficaz de la sustancia activa junto o en mezcla con excipientes inorgánicos u orgánicos, sólidos ó líquidos, farmacéuticamente utilizables, que sean adecuados para la administración enteral o parenteral. Así se emplean tabletas o cápsulas de gelatina que contengan la sustancia activa junto con diluyentes, por ejemplo, lactosa, dextrosa, sucrosa, manitol, sorbitol, celulosa y/o glicina, y lubricantes, por ejemplo, tierra de sílice, talco, ácido esteárico o sales del mismo, tales como estearato de magnesio o de calcio, y/o polietilenglicol; las tabletas contienen asimismo aglutinantes, por ejemplo, silicato de magnesio-aluminio, féculas, tales como fécula de maíz, de trigo, de arroz o de maranta, gelatina, traganta, celulosa metélica, celulosa carboximetélicasódica y/o polivinilpirrolidona, y, si se desea, medios de disgregación, por ejemplo, féculas, agar, ácido alginico o una sal del mismo, tal como alginato sódico, y/o mezclas efervescentes, o agentes de absorción, colorantes, sazonantes y edulcorantes. Además se pueden emplear los nuevos compuestos farmacológicamente activos en forma de preparados inyectables, por ejemplo, de administración intravenosa, o de soluciones de infusión. Tales soluciones preferentemente soluciones o suspensiones acuosas isotónicas, pudiéndose preparar éstas, por ejemplo, de preparados liofilizados que contengan la sustancia activa sola o junto con un excipiente, por ejemplo, manita, antes de su uso. Los preparados farmacéuticos pueden estar esterilizados y/o contener agentes auxi-

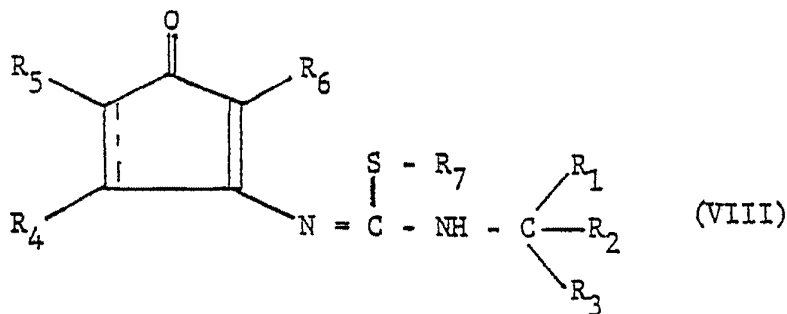
liares, tales como por ejemplo agentes de conservación, de estabilización, de humectación y/o emulsión, facilitadores de la solución, sales para regular la presión osmótica y/o tampones.

5. Los presentes preparados farmacéuticos que, si se desea, pueden contener otras sustancias farmacológicamente activas se preparan en forma en sí conocidas, por ejemplo, mediante procedimientos convencionales de mezcla, granulación, grageado, disolución o liofilización y contienen desde aproximadamente un 0,1 % hasta un 100 %, especialmente desde aproximadamente un 1 % hasta
10. aproximadamente un 50 %, los liofilizados hasta un 100 % de la sustancia activa.

- La dosificación puede depender de distintos factores, tales como forma de aplicación, especie, edad y/o estado individual. La dosis a administrar diariamente se encuentra en la
15. aplicación oral entre unos 10 mg y unos 1000 mg para seres de sangre caliente con un peso de unos 70 kg.

La invención se refiere también a las isotiureas de fórmula VIII

20.



25.

obtenibles como productos intermedios, donde  $R_1$  hasta  $R_6$  tienen el significado de arriba y  $R_7$  significa alquilo inferior, especialmente metilo.

30.

Los ejemplos a continuación sirven para la ilustración

de la invención: Las temperaturas se indican en grados centígrados.

Ejemplo 1

5. 9,8 g de 1,3-ciclopentadiona, 11,6 g de t-butil-urea, 0,2 g de ácido p-toluenosulfónico se calientan en 300 cc de ben-  
ceno-tolueno (1:1) durante 6 horas en el separador de agua. La fase orgánica se separa, el residuo se suspende en 200 cc de éster acético caliente y se separa por filtración de la resina insoluble. El filtrado se concentra, se mezcla con éter y se  
10. enfria. El cristalizado precipitado se separa por filtración y se lava a continuación con poco éster acético. El filtrado se reúne con la fase orgánica arriba separada, se evapora y se cromatografía el gel de sílice en una mezcla de éster acético-metanol-amoniaco (70:30:1). Por sublimación a continuación se  
15. separa la t-butil-urea aún existente. La 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea tiene un p.f. 193-195°.

En igual forma se puede obtener la 1-terc.-amil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea, p.f. 208-209°.

Ejemplo 2

20. 0,5 g de 1-amino-ciclopenten-(1)-ona-(3), 5 cc de t-butil-isocianato y 5 cc de dimetilformamida se calientan en un tubo de bomba durante 18 horas a 140°. Se enfria, se agrega me-  
tanol, se filtra y el filtrado se evapora hasta sequedad. El residuo se hierve con éster acético, se separa por filtración  
25. de un producto carbonaceo y el filtrado se evapora y se cromatografía en gel de sílice con éster acético-metanol (8:2). La 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea se recristaliza en isopropanol-éter. Tiene un p.f. de 193-195°.

Ejemplo 3

30. A una solución de alcoholato sódico preparada de 4,6 g

- de sodio y 300 cc de etanol absoluto se agregan bajo agitación 18,4 g de t-butil-urea y se calientan durante 15 minutos a 60°. A continuación se gotean 19,9 g de 1-etoxi-ciclopenten-(1)-ona-(3) en 25 cc de etanol absoluto en el transcurso de 5 minutos y
5. la solución clara se calienta durante 10 horas bajo reflujo. Después se evapora hasta sequedad, el residuo se disuelve en 100 cc de agua y se extrae 5 veces cada una con 150 cc de éster acético. Las fases orgánicas se reúnen, se seca y se evapora. El residuo se recristaliza en isopropanol-éter. La 1-terc.-butil-3-(2-
10. ciclopenten-1-on-3-il)-urea tiene un p.f. de 193-195°.

En igual forma se pueden obtener la 1-terc.-butil-3-(2-metil-2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea, p.f. 216-220° y la 1-(1-metil-1-ciclopentil)-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea, p.f. 182-183°.

15. Ejemplo 4

- 7,5 g de 1-amino-ciclopenten-(1)-ona-(3) se mezclan en 150 cc de dimetilformamida absoluta con 8,6 g de terc.-butilato potásico y bajo nitrógeno y agitación se calienta durante 1 hora a 90°. La suspensión marrón clara, espesa, se enfría y bajo
20. enfriamiento con hielo se gotean 11,1 g de terc.-butiltiocianato en 35 cc de dimetilformamida absoluta. La solución formada se agita durante 15 horas a temperatura ambiente. Después se neutraliza con 77 cc de ácido clorhídrico 1-n, se evapora hasta sequedad y la humedad adquirida se extrae con tolueno. El residuo se suspende en 250 cc de metanol caliente, se filtra y se
25. lava con metanol y éter. El filtrado metanólico se evapora hasta sequedad, el residuo se hierve con 250 cc de éter y se separa por filtración. El cristalizado se cromatografía entonces en gel de sílice en éster acético-metanol 8:2. Después se trata en
30. metanol con carbón animal, el filtrado se evapora hasta sequedad.

dad y se seca con tolueno. El residuo se recristaliza en isopropanol. La 1-terc.-butil-3-il)-tiourea tiene un p.f. 198-200°.

Ejemplo 5

5. Una mezcla de 2,26 g de 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-S-metil-tiourea, 0,6 g de cianamida finamente pulverizada y 10 cc de dimetilformamida absoluta, se agita bajo adición de 3 gotas de N,N-diisopropil-etilamina durante 48 horas a temperatura ambiente. Después se evapora bajo presión más reducida. El residuo se cromatografía en 100 g de gel de sílice empleándose  
10. se una mezcla de cloroformo-metanol (9:1) como mezcla eluyente. Después de recristalizar el producto purificado en acetato de etilo-éter de petróleo se obtiene la 1-terc.-butil-2-ciano-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-guanidina de p.f. 211 - 214°.

15. La 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-S-metil-tiourea empleada como producto de partida se puede obtener de la manera siguiente:

20. A una mezcla de 1,05 g de 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-tiourea, 0,7 g de carbonato potásico en 25 cc de alcohol etílico absoluto, se gotea bajo agitación una solución de 0,37 cc de ioduro metílico en 5 cc de alcohol etílico absoluto. Se agita aún durante 20 horas a temperatura ambiente y después se evapora bajo presión más reducida. El residuo se suspende en 50 cc de cloroformo y se filtra a través de Hyflo. El filtrado se evapora bajo presión reducida y el residuo se libera  
25. mediante tratamiento con tolueno de la humedad aún adherida. Después de frotar el residuo con dietiléter se obtiene como producto cristalino la 1-terc.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-S-metil-tiourea del p.f. 80-84°.

Ejemplo 6

30. 7,5 g de 1-amino-ciclopenten-(1)-ona-(3) se mezclan en

- 150 cc de dimetilformamida absoluta con 8,6 g de terc.-butilato potásico y bajo nitrógeno y agitación se calienta durante una hora a 90°. La suspensión espesa, marrón clara, se enfría y enfriando con hielo se gotean 9,5 g de sec.-butilisocianato en 35
5. cc de dimetilformamida absoluta. La solución formada se agita durante 15 horas a temperatura ambiente. Después se neutraliza con 77 cc de ácido clorhídrico l-n, se evapora hasta sequedad y la humedad adherida se retira con tolueno. El residuo se suspende en 250 cc de metanol caliente, se separa por filtración y
10. se lava con metanol y éter. El filtrado metanólico se evapora hasta sequedad, el residuo se hierve con 250 cc de éter y se separa por filtración. El cristalizado se cromatografía entonces en gel de sílice en éster acético-metanol 8:2. Seguidamente se trata en metanol con carbón animal, el filtrado se evapora
15. hasta sequedad y se seca con tolueno. El residuo se recrystaliza en isopropanol. Se obtiene así la 1-sec.-butil-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-urea.

#### Ejemplo 7

- 4,7 g de terc.-butilato potásico se presentan bajo agi-
20. tación en 100 cc de dimetilformamida absoluta. A esto se agrega bajo reacción ligeramente exotérmica a 35°C, 4,9 g de N"-ciano-N'-terc.-butil-guanidina y la mezcla se agita durante 2 horas a 50°C de temperatura de reacción. Después se gotea en el trans-
25. curso de 30 minutos una solución de 4,4 g de 1-etoxi-ciclopentan-(1-)ona-(3) en 50 cc de dimetilformamida absoluta y se sigue agitando aún durante 3 horas a 50°C. Después se enfría, se neutraliza con 42 cc de ácido clorhídrico l-n y se evapora hasta sequedad. El residuo se disuelve en cloroformo y se lava en agua. Después de secar las fases orgánicas reunidas se descolorea con
30. Florisil y se evapora. El residuo se recrystaliza en alcohol

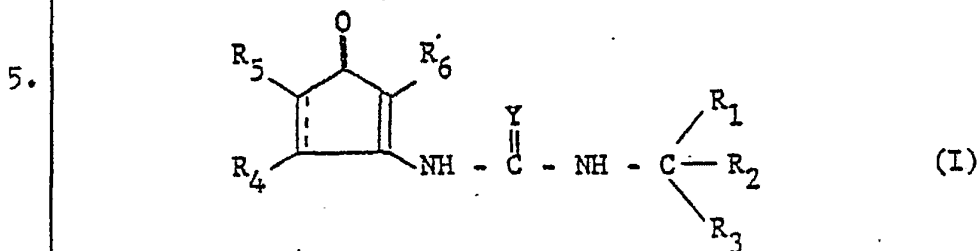
isopropílico-diethyléter y se obtiene como cristalizado blanco la 1-terc.-butil-2-ciano-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-guanidina, del p.f. 211-214°C.

5. En igual forma se puede obtener la terc. amil-2-ciano-3-(2-ciclopenten-1-on-3-il)-guanidina del p.f. 135,5-137,5°.

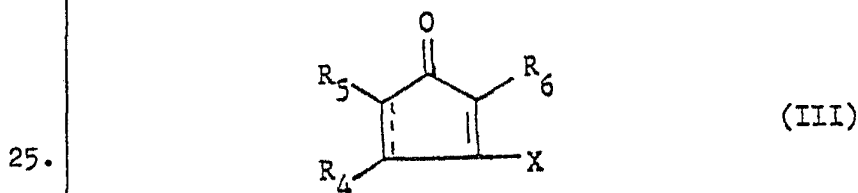
10. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas, son susceptibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental.

REIVINDICACIONES

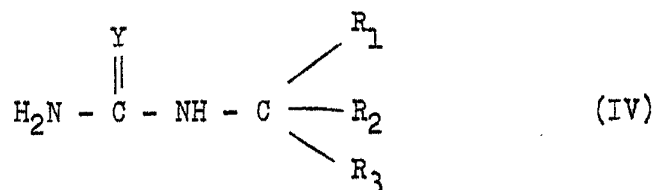
1.- Procedimiento para la obtención de 3-oxo-ciclopent-  
tenil-úreas de fórmula I



10. cuyo anillo ciclopentenílico pueden mostrar un ulterior enlace  
doble y donde  $R_1$  significa hidrógeno o alquilo inferior,  $R_2$  sig-  
nifica alquilo inferior y  $R_3$  significa alquilo inferior, en ca-  
so dado insaturado, o  $R_2$  y  $R_3$  junto con el átomo de carbono que  
los une cicloalquiló, en caso dado insaturado, o  $R_1$ ,  $R_2$  y  $R_3$   
15. junto con el átomo de carbono que los une, fenilo en caso dado  
sustituido,  $R_4$  significa hidrógeno, alquilo inferior o fenilo,  
en caso dado sustituido,  $R_5$  significa hidrógeno, un grupo car-  
boxi o nitrilo, en caso dado esterificado o amidado, y  $R_6$  sig-  
nifica hidrógeno o alquilo inferior, e Y está por oxígeno, azu-  
20. fre, el grupo imino o el grupo cianimino, caracterizado porque  
un compuesto de fórmula III

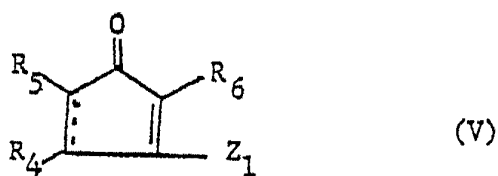


donde X significa hidroxí, en caso dado esterificado o eterado,  
se hace reaccionar con un compuesto de fórmula IV



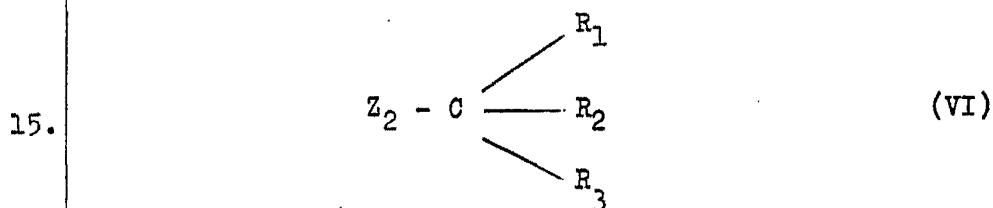
5.

o porque un compuesto de fórmula V



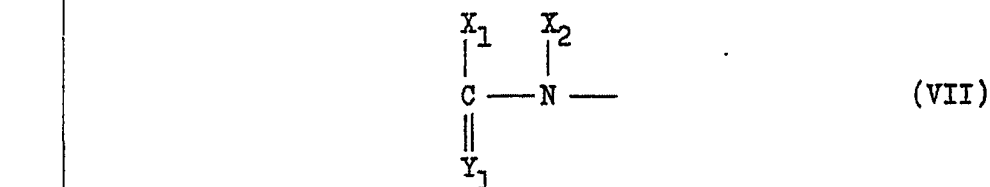
10.

se hace reaccionar con un compuesto de fórmula VI



15.

20. donde uno de los restos  $\text{Z}_1$  y  $\text{Z}_2$  significa un grupo amino y el otro corresponde al grupo VII



25.

30. donde  $\text{X}_1$  significa hidroxilo o mercapto, en caso dado esterificado o eterado, capaz de reacción, y  $\text{X}_2$  significa hidrógeno, o  $\text{X}_1$  y  $\text{X}_2$  juntos forman un enlace entre C y N, e  $\text{Y}_1$  significa oxígeno, azufre, imino o cianimino, bajo la condición de que

en caso de que  $Y_1$  signifique imino o cianimino,  $X_1$  signifique halógeno y  $X_2$  hidrógeno y, si se desea, en los compuestos obtenidos, donde Y significa el grupo imino o S, éste se transforma en el átomo de oxígeno.

5.                   2.- Procedimiento según la reivindicación 1, caracterizado porque se parte de un compuesto que se obtiene en cualquier etapa del procedimiento como producto intermedio y se realizan las etapas del procedimiento que faltan, o el procedimiento se interrumpe en cualquier etapa.

10.                   3.- Procedimiento según la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque un producto de partida se forma bajo las condiciones de reacción o en las cuales un componente de reacción se presenta en caso dado en forma de sus sales.

15.                   4.- Procedimiento para la obtención de 3-oxo-ciclopentenil-ureas, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

Esta Memoria consta de 17 hojas escritas a máquina por una sola cara.

20.

Madrid, 23 ABR. 1979  
CIBA-GEIGY AC.-  
J. M. GÓMEZ ACEBO Y POMBA  
p. p. firmado: Alejandro Collo López