

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 42189

12
Kl. o, 7/03

Instytut Farmaceutyczny *)

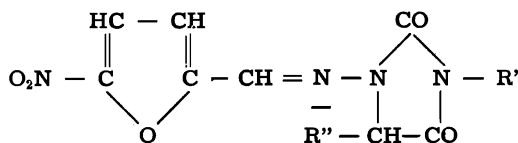
Warszawa, Polska

Sposób otrzymywania zasad Schifffa pochodnych 5-nitrofurfuralu i 1-amino-hydantoin

Patent trwa od dnia 27 sierpnia 1957 r.

Przedmiotem wynalazku jest sposób otrzymywania zasad Schifffa pochodnych 5-nitrofurfuralu i podstawionych 1-amino-hydantoin na drodze kondensacji 5-nitrofurfuraldoksymu z odpowiednią aminową pochodną hydantoiny. Sposób według wynalazku pozwala na otrzymywanie z dużą wydajnością wymienionych związków stosując proste operacje technologiczne.

Związki, których otrzymywanie obejmuje sposób według wynalazku można przedstawić następującym wzorem ogólnym:

gdzie R' = H lub CH₃ i R'' = H lub CH₃

*) Właściciel patentu oświadczył, że współtwórcami wynalazku są mgr Alicja Świrska i mgr inż. Jerzy Lange.

W szczególności wynalazek dotyczy otrzymywania N-(5-nitro-2-furfurylideno)-1-amino-hydantoiny, który to związek wykazuje najwyższą czynność bakteriostatyczną i bakteriobójczą spośród pozostałych związków tego szeregu i z tego względu stosowany jest szeroko w medycynie jako środek dezynfekcyjny dróg moczowych.

Znany dotychczas sposób otrzymywania N-(5-nitro-2-furfurylideno)-1-amino-hydantoin opierał się na reakcji kondensacji 1-aminohydantoin z dwuocetanem 5-nitrofurfuralu (Hayes patent Stanów Zjednoczonych Ameryki nr 2610181), sposób ten jednak nie jest ekonomiczny, ze względu na wysoki koszt dwuocetanu 5-nitrofurfuralu, otrzymywanego z furfuralu przy dużym zużyciu bezwodnika octowego.

Stwierdzono, że N-(5-nitro-2-furfurylideno)-1-amino-hydantoiny otrzymuje się z bardzo dobrymi wydajnościami przez analogiczną kondensację 1-amino-hydantoin z 5-nitrofurfuraldoksymem, który jest surowcem znacznie łatwiejszym do przemysłowego otrzymywania, np. na drodze

opisanej przez Nenitzescu i Bucur (Rev. Chim., 1, 155/1956).

Sposobem według wynalazku otrzymuje się N- (5-nitro-2-furfurylideno-1-amino-hydantoiny przez ogrzewanie 1-amino-hydantoin z 5-nitro-furfuraldoksymem w środowisku rozcieńczonego alkoholu etylowego o stężeniu nie przekraczającym 75% z dodatkiem mocnego kwasu mineralnego za wyjątkiem kwasu azotowego, jako czynnika ułatwiającego rozkład oksymu. Do tego celu można stosować zamiast wyodrębnionych 1-amino-hydantoin ich roztwory, otrzymywane według Traube i Hoffa (Ber., 31, 167/1898) przez działanie cyjanianu na kwas hydrazyno-tłuszczowy i dalszą cyklizację otrzymywanego przejściowo produktu niescyklizowanego.

Oczyszczanie surowej N-(5-nitro-2-furfurylideno-1-aminohydantoiny prowadzi się drogą kryształizacji z pirydyny lub rozcieńczonego kwasu octowego.

Przykład. 239 g chlorowodorku estru etylowego kwasu hydrazyno-octowego, 155 g cyjanianu potasu rozpuszcza się w 3100 ml wody i ogrzewa przez 2 godziny. Następnie wprowadza się roztwór 205 g stężonego kwasu siarkowego w 770 ml wody, ogrzewa dalsze 2 godziny doda-

je się 121 g 5-nitrofurfuraldoksymu i 950 g alkoholu etylowego. Następnie po 1-godzinnym ogrzewaniu mieszaninę chłodzi się do temperatury pokojowej, odsącza osad, przemywa go wodą i suszy w temperaturze 80°. Otrzymuje się około 110 g N-(5-nitro-2-furfurylideno)-1-amino-hydantoiny co stanowi około 60% wydajności teoretycznej przeliczonej na 5-nitrofurfuraldoksym.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób otrzymywania zasad Schiffa pochodnych 5-nitrofurfuralu i 1-amino-hydantoin, znamienny tym, że działa się 1-amino-hydantoiną na 5-nitrofurfuraldoksym.
2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tym, że reakcję prowadzi się w obecności mocnego kwasu mineralnego za wyjątkiem kwasu azotowego.
3. Sposób według zastrz. 1, 2, znamienny tym, że proces prowadzi się w środowisku rozcieńczonego alkoholu etylowego o stężeniu nie przekraczającym 75%.

Instytut Farmaceutyczny
Zastępca: mgr inż. Witold Hennel,
rzecznik patentowy