

## Arylsulfonylureido- und Arylsulfonylamidoacyl-derivate von Oxy- und Oxo-cycloalkanen als potentielle Antidiabetica

### 3. Vorläufige Mitt.<sup>1</sup>: 1-Tosylureidomethyl-cycloalkan-1-ole

*Arylsulfonylureido and Arylsulfonyl Amidoacyl Derivatives of Hydroxy and Oxo Cycloalkanes as Potential Antidiabetics (III, Preliminary Communication): 1-Tosylureidomethyl Cycloalkan-1-ols*

Von

**H. Egg**

Aus dem Institut für organische und pharmazeutische Chemie  
der Universität Innsbruck

*(Eingegangen am 29. Juli 1969)*

Die hypoglykämische Aktivität der in den beiden vorhergehenden Mitteilungen<sup>1, 2</sup> beschriebenen Tosylcarbamoylderivate von 2-Aminocyclohexanolen erregte den Wunsch, noch andere Tosylcarbamoylderivate von leicht erhältlichen cycloaliphatischen 1,2-Aminolen kennenzulernen.

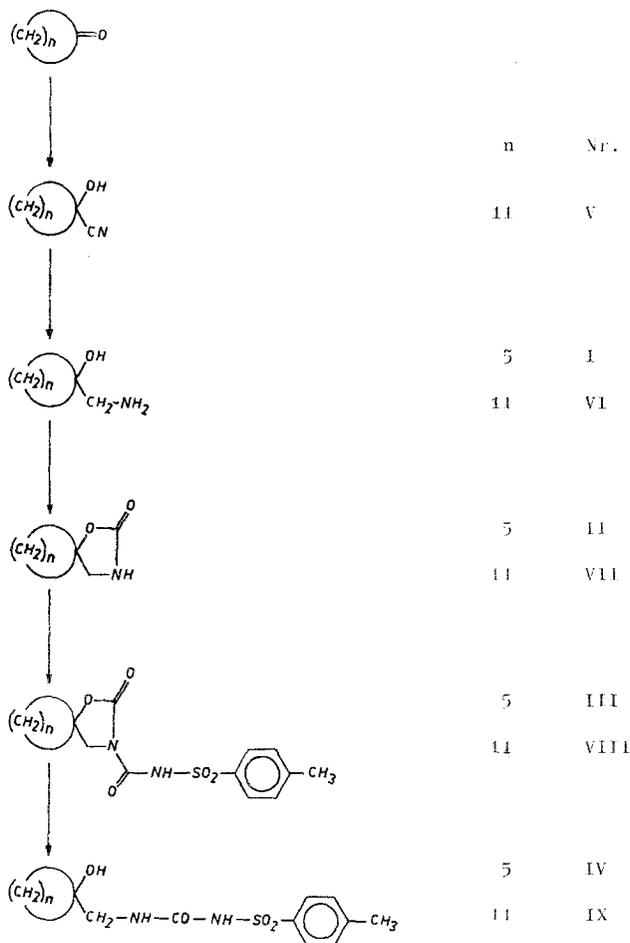
Es wurden dazu die 1-Aminomethyl-cycloalkan-1-ole gewählt. Zur Vermeidung der O,N-Tosylcarbamoylierung wurden die 1-Aminomethyl-cycloalkanole mit  $\text{COCl}_2$  in die Spirooxazolidone übergeführt, welche mit Tosylisocyanat die 3-Tosylcarbamoylderivate lieferten. Diese ergaben bei alkalischer Hydrolyse unter Ringöffnung und  $\text{CO}_2$ -Abspaltung in ausgezeichneter Ausbeute die gesuchten 1-Tosylureidomethyl-cycloalkan-1-ole.

Zur Umsetzung gelangten 1-Oxa-3-azaspiro[4,5]decan-2-on (II) ( $n = 5$ ) und 1-Oxa-3-azaspiro[4,11]hexadecan-2-on (VII) ( $n = 11$ ).

<sup>1</sup> H. Egg, 2. vorl. Mitt., Mh. Chem. **100**, 2125 (1969).

<sup>2</sup> H. Bretschneider und H. Egg, 1. vorl. Mitt., Mh. Chem. **100**, 2122 (1969).

Zur Herstellung des von *Newman*<sup>3</sup> durch *Curtius*-abbau von 1-Cyclohexanolessigsäurehydrazid gewonnenen II wurde folgender Weg beschritten: Cyclohexanonecyanhydrin<sup>4</sup> wurde nach *Nace* und *Smith*<sup>5</sup> mit



$\text{LiAlH}_4$  zum 1-Aminomethyl-cyclohexanol (I) reduziert, welches sich mit  $\text{COCl}_2$  zu II cyclisierte. Kupplung mit Tosylisocyanat zu III und anschließende alkalische Hydrolyse führte zum bereits durch andere

<sup>3</sup> *M. S. Newman*, J. Amer. Chem. Soc. **71**, 378 (1949).

<sup>4</sup> *J. D. Billimoria* und *N. F. MacLagan*, J. Chem. Soc. **1951**, 3067.

<sup>5</sup> *H. R. Nace* und *B. B. Smith*, J. Amer. Chem. Soc. **74**, 1861 (1952).

Autoren bekannten, auf anderem Wege erhaltenen 1-Tosylureidomethylcyclohexanol (IV)<sup>6</sup>.

Dieselbe Reaktionsfolge diene zur Synthese der Cyclododecyl-derivate V—IX.

Für die Anregung zu dieser Arbeit möchte ich Herrn Professor Dr. *H. Bretschneider* meinen Dank aussprechen, desgleichen für die sachliche Unterstützung den Firmen Hoffmann-La Roche A.G., Wien und Basel.

---

<sup>6</sup> *F. J. Marshall, M. V. Sigal, H. R. Sullivan, C. Cesnik und M. A. Root, J. Med. Chem. 6, 60 (1963).*