

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

4. Vorläufige Mitt.¹: Arylsulfonylcarbamoyl-*cis*-cyclohexano- [*d*]oxazolidone und deren Umwandlung in *cis*-2-Arylsulfonyl- ureido-cyclohexanole

*Arylsulfonylureido and Arylsulfonylamidoacyl Derivatives of
Hydroxy and Oxo Cycloalkanes as Potential Antidiabetics (IV,
Preliminary Communication): Arylsulfonylcarbamoyl cis-Cyclo-
hexano[*d*]oxazolidones and Their Transformation into cis-2-Aryl-
sulfonylureido Cyclohexanols*

Von

H. Bretschneider und H. Egg

Aus dem Institut für organische und pharmazeutische Chemie
der Universität Innsbruck

(Eingegangen am 29. Juli 1969)

In Fortsetzung unserer Arbeiten über Hydroxyalkyl-tosylharnstoffe wurde ausgehend vom *trans*-2-Chlorcyclohexyl-carbamat (I) ein weiteres Darstellungsverfahren von *cis*-2-Arylsulfonylureido-cyclohexanolen gefunden, das dank der guten Zugänglichkeit des Ausgangsmaterials und der zum Teil ausgezeichneten Ausbeuten eine wesentliche Verbesserung gegenüber den in der 1. Mitteilung² beschriebenen Synthesen darstellt.

I wurde nach Jones³ aus Cyclohexenoxid in zweistufiger Reaktion zu ca. 70% hergestellt. Kupplung von I mit Tosylisocyanat in Benzol führte zum Allophanat (II), welches sich im System Dimethylsulfoxid/NaH unter Inversion zum 3-Tosylcarbamoyl-*cis*-cyclohexano[*d*]oxazolid-2-on (III) cyclisierte. Das Vorliegen von III wurde durch Zweitsynthese aus *cis*-Cyclohexano[*d*]oxazolid-2-on (V) und Tosylisocyanat bestätigt. Hydro-

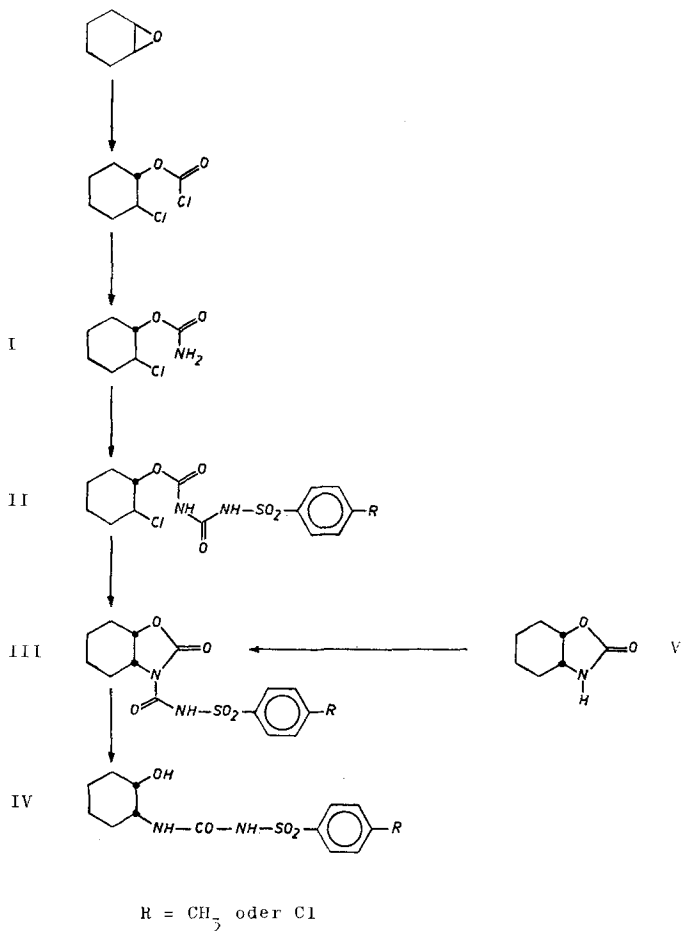
¹ H. Egg, 3. vorl. Mitt., Mh. Chem. **100**, 2128 (1969).

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

³ J. I. Jones, J. Chem. Soc. **1957**, 2735.

lytische Ringöffnung mit verd. Alkali führte schließlich zum *cis*-2-Tosylureido-cyclohexanol (IV).

Dieselbe Reaktionsfolge wurde auch mit den *p*-Chlorphenylsulfonylederivaten durchgeführt.



Den Firmen Hoffmann-La Roche A.G., Wien und Basel, sei für die verschiedentliche Förderung dieser Arbeit verbindlichst gedankt.