



1967

327392

327392

PATENTE DE INVENCION

a favor de:

FARBWERKE HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, vormalis Meister Lucius & Brüning, de nacionalidad alemana, residente en Frankfurt (M) - Hoechst (República Federal Alemana), por:

"PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE 2-ETILAMINO-4-FENIL-6-CLORO-4H-3,1-BENZOXAZINA".

Memoria descriptiva

Es objeto del invento un procedimiento para la preparación de 2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzoxazina, que se caracteriza porque se hace reaccionar 5-cloro-2-aminobenzhidrol con isocianato de etilo y se trata con ácidos la N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxibencil)]-fenilurea obtenida.

5

El producto del procedimiento, junto a escasa toxicidad, posee varias propiedades farmacológicas, en especial una acción sicotrópica. Sirve para el tratamiento de enfermedades síquicas, por ejemplo depresiones, siconeurosis, disgustos y estados de ansiedad de génesis neurótica y sicótica.

10

327392



b. 1967

Ejemplo

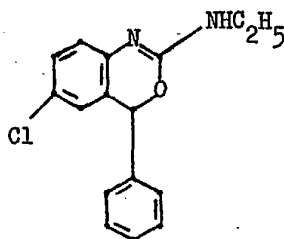
- 15 a) A una solución de 23 g de 2-amino-5-cloro-benzhidrol en 250 ml de éter se le añaden a gotas, con agitación, y enfriando con hielo, 7,1 g de isocianato de etilo recién destilado en 30 ml de éter durante 30 minutos. Se sigue agitando todavía 30 minutos a temperatura ambiente, se elimina a continuación el disolvente en el vacío y se obtienen 25 g de N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxibencil)]-fenil-urea en forma de aceite que se sigue trabajando directamente como tal.
- 20 b) El producto obtenido según a) se calienta con 75 ml de ácido clorhídrico concentrado durante 5-10 minutos con agitación sobre baño de vapor y a continuación se enfría rápidamente. Se diluye con agua, se decanta, se recoge el residuo semisólido con cloruro de metileno y se agita con lejía sódica diluida. La solución en cloruro de metileno se lava con agua, se seca sobre sulfato sódico y se concentra por evaporación. La 2-etil-amino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzoxazina bruta que queda cristaliza desde benceno/éter de petróleo en forma de cristales incoloros de p. de f. 124-125°. Rendimiento, 18 g.

25
30 Esta solicitud corresponde a las presentadas en Alemania el 3 de Junio de 1.965 bajo el número F 46 229, IVd/12p, y 22 de Marzo de 1.966 bajo el número F 48 726 IVd/12p, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto de la Propiedad Industrial y del artículo 4º del Convenio de la Unión.

REIVINDICACIONES

=====

- 35 1). Procedimiento para la preparación de 2-etilamino-4-fenil-6-cloro-4H-3,1-benzoxazina, de la fórmula



327392



lb. 1967

45
caracterizado porque se hace reaccionar 5-cloro-2-aminobenzhidrol con isocianato de etilo y la N-etil-N'-[4-cloro-2-(alfa-hidroxibencil)]-7-fenilurea obtenida se trata con ácidos.

2). "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE 2-ETILAMINO-4-FENIL-6-CLORO-4H-3,1-BENZOXAZINA".

Esta Memoria consta de tres hojas foliadas y mecanografiadas por un sólo lado de sus caras.

Madrid, 31 de Mayo de 1966

ba