

IV.



3 75
536988

P A T E N T E D E I N V E N C I Ó N
=====

a favor de

SOCIÉTÉ D'ETUDES SCIENTIFIQUES ET INDUSTRIELLES DE L'ILE DE FRANCE -
De nacionalidad francesa - domiciliada en 46, Boulevard de Latour-
Maubourg, PARÍS (Francia),

por:

"Procedimiento para preparar 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenoles".

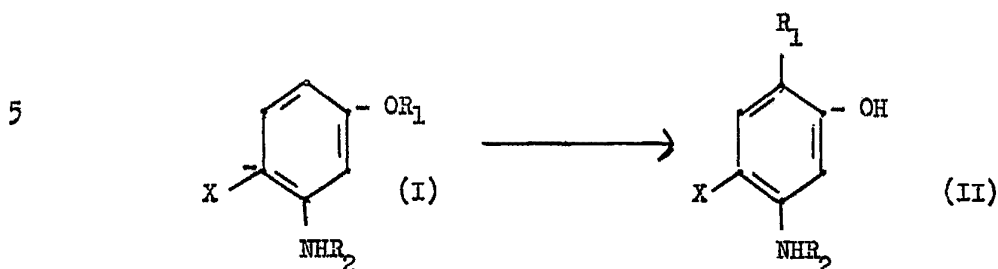
-----:oOo:-----

Memoria descriptiva.

Este invento se refiere a un procedimiento para preparar
2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenoles, el cual comprende calentar un
derivado de 3-acilamino-4-halofenol de fórmula general (I), en pro-



sencia de un catalizador, para efectuar la resíntesis de Fries y obtener un 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenol de fórmula general :



donde R_1 es un grupo alcanoilo; R_2 es un grupo acilo, y X es un átomo de halógeno. El grupo alcanoilo puede ser, por ejemplo, acetilo, propionilo, butirilo ó valerilo. Ejemplos de grupo acilo pueden ser un residuo de ácido carboxílico alifático, como acetilo, cloroacetilo, metoxiacetilo, propionilo, butirilo, valerilo ó ciclohexancarbo-
 10 nilo; un residuo de ácido carboxílico aromático, como benzoilo, toluilo, fenacetilo, fenilpropionilo, naftoilo ó anisoilo; y un residuo de ácido carboxílico heterocíclico, como nicotinoilo ó furoilo. Los halógenos pueden ser, por ejemplo, cloro y bromo.

La reacción de este invento comprende calentar el derivado de 3-acilamino-4-halofenol de fórmula general (I) en presencia de un
 20 catalizador, para realizar la resíntesis de Fries. Como catalizador puede servir el empleado habitualmente en el mismo, como cloruro de cinc, cloruro de aluminio, cloruro de hierro, cloruro de estaño; bromuros de aluminio, de bismuto, de titanio, de antimonio; cloruro de hidrógeno, fluoruro de hidrógeno, trifluoruro de boro ó pentacloruro de fósforo. La presente reacción es factible sin disolvente,
 25 pero puede emplearse uno indiferente a ella, como disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, nitrobenzono, clorobenceno ó tetracloroetano.

Los 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenoles (II) así obtenidos
 30 son originales y útiles como productos intermedios en la producción



de medicamentos de notables propiedades farmacológicas, como analgésicas, espasmolíticas, sedantes, narcóticas y antieméticas, por ejemplo, N-(2-dialquilaminoalquil)-2-alcóxi-4-amino-5-halobenzamidas.

El siguiente ejemplo se ofrece como ilustración de este invento.

5

EJEMPLO 1
=====

A una suspensión de 22 g de cloruro de aluminio anhidro en 20 ml de disulfuro de carbono, se añaden 25 g de acetato de 3-acetamido-4-clorofenilo, y la mezcla resultante se calienta en un baño de aceite. Despues de retirar el disulfuro de carbono por evaporación, la mezcla obtenida se calienta cuatro horas a 160 °C. Terminada la reacción, la mezcla se trata con solución acuosa de ácido clorhídrico a 10 %, y se extracta con acetato de etilo. El extracto se lava con agua, se seca, y se concentra, para obtener 0,8 (32 %) de 2-hidroxi-4-acetamido-5-cloroacetofenona, en forma de cristales blancos, p. fus. 207 a 208 °C.

10

15

Análisis para C₁₀H₁₀NO₃Cl:

Calculado : C, 52,75; H, 4,42; N, 6,15; Cl, 15,57.

Hallado : C, 52,74; H, 4,67; N, 6,14; Cl, 15,66.

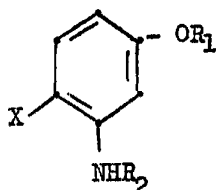
20

N O T A
=====

Se reivindica como objeto de la presente patente :

1. - Procedimiento para preparar 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenoles, caracterizado porque se calienta un derivado de 3-acilamino-4-halofenol de fórmula general :

25



336988

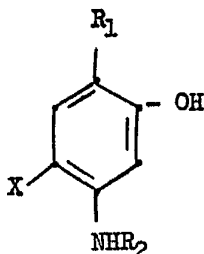
F3

FEB



donde R_1 es un grupo alcanoilo, R_2 es un grupo acilo y X es un átomo de halógeno, en presencia de un catalizador, para efectuar la resíntesis de Fries y obtener un 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenol de fórmula general :

5



10

donde R_1 , R_2 y X tienen los mismo significados antedichos.

2. - Procedimiento para preparar 2-alcanoil-4-halo-5-acilaminofenoles.

Esta memoria consta de cuatro páginas, escritas por una sola cara.

BARCELONA,

3 FEB. 1967

P. A.