

378019

P. 44.250

Serie 1.663

378019



**Memoria descriptiva**

SECCION TECNICA
CLASIFICACION IPC
CLASE <u>C07</u>
SUBCLASE <u>C</u>

para solicitar PATENTE DE INVENCION EN ESPAÑA por 20 años

a nombre de LIPHA, LYONNAISE INDUSTRIELLE PHARMACEUTIQUE

entidad / ~~de nacionalidad~~ francesa

con domicilio en 115, Avenue Lacassagne, Lyon, Francia

por: "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CINAMAMIDAS"

(Clase Internacional C07c)

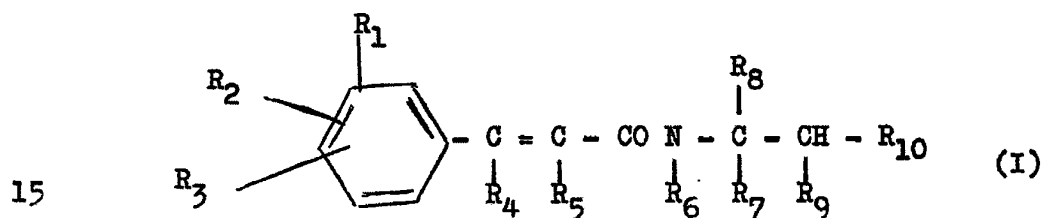


El presente invento se refiere a cinamamidas sustituidas.

Ya se conocen ciertos derivados de las cinamamidas. Especialmente, la N-(hidroxi-2-etil)-cinamamida ha sido preparada por O.K. Behrens y otros J. Biol. Chem. 175-171-92-(1948). Estos autores han estudiado esta molécula únicamente como intermedia de biosíntesis.

El presente invento concierne, en particular, a nuevas cinamamidas sustituidas.

Las nuevas cinamamidas están representadas por la fórmula:



en la cual  $R_1$  y  $R_3$  son cada uno hidrógeno, un radical alcoholo inferior o alcoxi inferior;  $R_2$  es hidrógeno, un halógeno, un radical alcoholo inferior o alcoxi inferior;  $R_4$  y  $R_5$  son cada uno hidrógeno o un radical alcoholo inferior;  $R_6$  es hidrógeno, un radical alcoholo inferior, hidroxialcoholo inferior, arilo o  $C_2H_5NHCOO - C_2H_4$ ;  $R_7$  y  $R_8$  son cada uno hidrógeno, un radical alcoholo inferior o hidroxialcoholo inferior;  $R_9$  es hidrógeno, un radical alcoholo inferior o hidroxialcoholo inferior;  $R_{10}$  es un halógeno, un radical hidroxi - salvo cuando  $R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$ ,  $R_7$ ,  $R_8$  y  $R_9$  son hidrógeno - y, cuando  $R_1$ ,  $R_2$ , y  $R_3$  son un radical metoxi,  $R_4$  es el radical metilo y  $R_5$  a  $R_9$  son hidrógeno - un radical hidroxialcoholo inferior,  $NH_2COO$ , alcoholo inferior  $-NHCOO$  y aril  $-NHCOO$ .

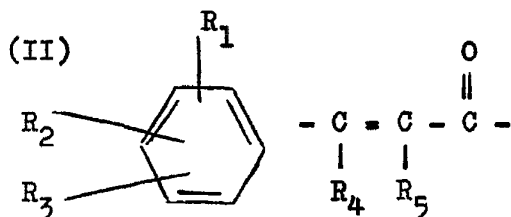
Los compuestos del invento, en cuya fórmula  $R_{10}$

378019



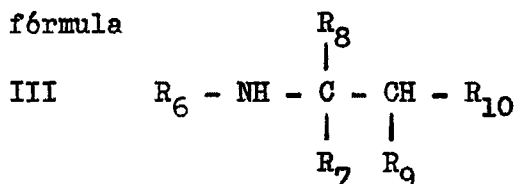
es el radical hidroxilo, alcoholo inferior o hidroxialcoholo inferior, se obtienen por condensación de un derivado reactivo de un ácido cinámico capaz de proporcionar el grupo representado por la fórmula (II),

5



10

en la cual R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub> tienen los mismos significados que precedentemente, con una hidroxialcoholamina de fórmula



15

en la cual R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub> y R<sub>9</sub> tienen los mismos significados que precedentemente y R<sub>10</sub> es un radical hidroxilo, o hidroxialcoholo inferior.

20

El derivado reactivo del ácido cinámico es preferentemente un cloruro de ácido, el anhídrido de ácido o un éster.

25

La transformación de los ácidos cinámicos, que puede permitir la introducción del grupo de fórmula (II), puede efectuarse por medio de diversos reactivos. A este efecto, pueden utilizarse el tricloruro de fósforo, el tribromuro de fósforo, el pentacloruro de fósforo, el pentabromuro de fósforo, el oxiclорuro de fósforo, el cloruro de sulfurilo o el cloruro de tionilo. No obstante, se prefiere utilizar el cloruro de tionilo para la preparación de los cloruro de ácidos intermedios correspondientes.

30

Se puede efectuar la reacción a temperaturas com



28

prendidas en el intervalo de aproximadamente 20°C a aproximadamente 100°C en la ausencia de un disolvente o en un disolvente que no entra en reacción en las condiciones empleadas. Estos disolventes pueden ser, por ejemplo, cloroformo, cloruro de metileno, éter, tetracloruro de carbono, benceno y análogos.

Se trata a continuación el halogenuro de ácido obtenido con la hidroxí-alcoholamina apropiada. Puede efectuarse esta reacción a temperaturas comprendidas en el intervalo de aproximadamente 5°C a aproximadamente 50°C. Por poder ser exotérmica la reacción, se prefiere efectuarla en un disolvente que no entra en reacción en las condiciones empleadas. Los disolventes que se pueden utilizar son, por ejemplo, cloroformo, dioxano, tetrahidrofurano y análogos. Igualmente, se puede emplear un aceptador de ácido tal como sosa, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, piridina, trietilamina, dimetilnilina. En ciertos casos, la hidroxialcoholamina puede actuar como su propio aceptador de ácido, empleando un exceso de al menos dos veces de este último.

La transformación de los ácidos cinámicos en anhídridos de ácidos correspondientes se puede efectuar fácilmente por la interacción de un ácido cinámico con su halogenuro de ácido correspondiente: Se trata a continuación el anhídrido de ácido resultante con una hidroxí-alcoholamina apropiada, obteniendo la amida deseada.

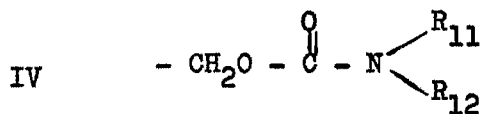
Se pueden preparar con facilidad los ésteres alcohólicos de los ácidos cinámicos por procedimientos de esterificación normales. La amidación de los ésteres intermedios puede efectuarse por tratamiento con una hidroxial-



cohilamina apropiada en condiciones bien conocidas en la técnica.

5 La transformación de los alcoholes, según la fórmula I, en halogenuros correspondientes, se realiza con facilidad por medio de diferentes reactivos, por reacción del alcohol considerado con un reactivo halogenado. El cloruro de tionilo es el reactivo preferido del invento. Puede efectuarse la reacción a temperaturas comprendidas en el intervalo de aproximadamente 10°C a aproximadamente 50°C en un disolvente que no entra en reacción en las condiciones empleadas. El benceno es el disolvente preferido del invento. Puede emplearse igualmente un aceptador de ácido tal como piridina.

15 La transformación de los alcoholes, según la fórmula I, en carbamatos se realiza por medios de un agente de acilación de tipo ácido carbámico apropiado. La expresión "agente de acilación de tipo de ácido carbámico" tal como se utiliza aquí, designa uno o varios compuestos capaces de transformar un grupo  $-\text{CH}_2\text{OH}$  en un grupo representado por la fórmula IV

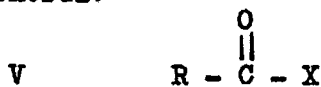


en la cual  $\text{R}_{11}$  y  $\text{R}_{12}$  son cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alcohilo o arilo, en una o varias etapas de reacción. Los procedimientos de transformación de los grupos hidroxilo en grupos carbamato son bien conocidos en la práctica, y se puede aplicar cualquier procedimiento de este género que proporcione los carbamatos deseados del invento.

30 Un procedimiento de preparación muy cómodo con-



siste en hacer reaccionar el alcohol de fórmula general (I) ( $R_{10} = OH$  o un radical hidroxialcohilo) con un agente de fórmula general:



5 en la cual R es un átomo de halógeno, un radical alcoxi o un radical ariloxi y X es un átomo de halógeno; y en hacer reaccionar el compuesto intermedio así formado con amoníaco o con una amina de fórmula general



en la cual  $R_{11}$  y  $R_{12}$  tienen los mismos significados que en la fórmula IV.

15 Preferentemente, se utiliza el fosgeno en la primera etapa y el amoníaco en la segunda etapa. El amoníaco puede estar presente, por ejemplo, bajo forma de hidróxido de amonio. El carbamato resultante puede obtenerse por procedimientos clásicos, tales como extracción, concentración y cristalización.

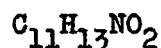
20 Como variante, se puede hacer reaccionar el alcohol de fórmula general I ( $R_{10} = OH$  o un radical hidroxialcohilo) con un isocianato de alcohol o de arilo apropiado.

Además, la utilización de isocianato proporciona carbamatos de los cuales  $R_{11}$  es un átomo de hidrógeno y  $R_{12}$  es un radical alcohol o arilo.

25

Se dan a continuación ejemplos de preparación de compuestos del presente invento.

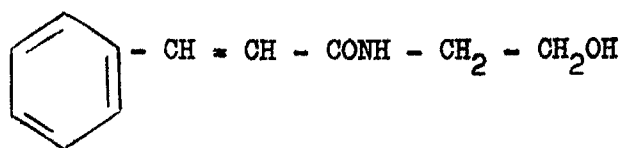
Ejemplo 1. N-(hidroxi-2-etil)-cinamamida.



P.M. = 191,22

30

21.3.70



5 Se añade gota a gota bajo agitación, una solución de 968,4 g (5,8 moles) de cloruro de cinamoilo en 1000 ml de dioxano a una solución de 835,2 g (11,6 moles + 20%) de etanolamina en 800 ml de dioxano. Se mantiene la temperatura a los alrededores de 20°C. Al final de la adición, se agita durante una hora a temperatura ordinaria, se  
 10 vierte en agua helada + ácido clorhídrico, se filtra con succión el precipitado formado, se lava con agua bicarbonatada y después con agua. El producto obtenido después de una extracción con cloroformo sobre las aguas madres, es reunido con el obtenido después de secado.

15 El rendimiento es del orden de 85 a 95% de producto que cristaliza en acetato de etilo o acetona, bajo forma de bellos cristales blancos. P. de F. = 100,5-102,5°C.

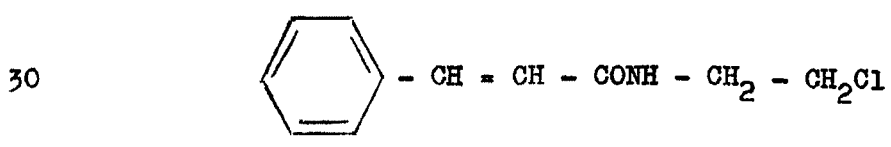
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
20 Calculado	69,09	6,85	7,33
Encontrado	69,33	6,70	7,53

Espectro de infrarrojos (K Br)

ν OH - NH	3.300 cm <sup>-1</sup>
ν CO	1.660 cm <sup>-1</sup>
25 δ CH de CH = CH trans	975 cm <sup>-1</sup>
5 H adyacentes sobre el fenilo	715-770 cm <sup>-1</sup>

Ejemplo 2. N-(cloro-2-etil)-cinamamida.





28

A una solución de 11,4 g ( $\frac{0,6 \text{ moles}}{10}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)cinamamida y de 4,8 g ( $\frac{0,6 \text{ moles}}{10}$ ) piridina, en 40 ml de benceno destilado sobre sodio, se añaden gota a gota, a temperatura inferior o igual a 45°C: 7,2 g ( $\frac{0,6 \text{ moles}}{10}$ ) de cloruro de tionilo. Se mantiene en ebullición durante 4 horas. Se recoge con agua, se extrae con benceno, se seca sobre sulfato de sodio, se expulsa el disolvente. El rendimiento es del orden de 74% de producto que cristaliza en una mezcla (1/0,5) de hexano-dicloroetano bajo forma de lentejuelas de color canela. P. de f. 103-104,5°C (en tubo capilar).

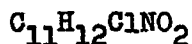
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	62,99	5,77	6,68	16,91
Encontrado	63,05	5,79	6,53	16,97

Espectro de infrarrojos: (K Br)

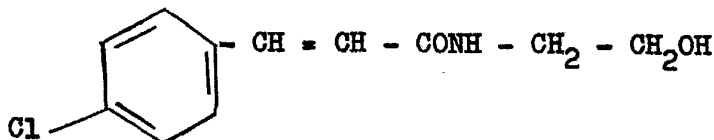
$\nu$ NH	3.260 $\text{cm}^{-1}$
$\nu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	970 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	735 - 770 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 3. N-(hidroxi-2-etil)-para-cloro-cinamamida.



P.M. = 225,68

25



30

Siguiendo las condiciones operatorias del ejemplo 1, a partir de 8 g ( $\frac{0,4 \text{ moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido para-cloro-cinámico, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de agujas blancas en acetato de etilo y funde a



137-138,5°C en tubo capilar.

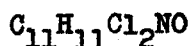
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	58,53	5,36	6,21	15,71
5 Encontrado	58,72	5,29	6,06	15,62

Espectro de infrarrojos: (K Br)

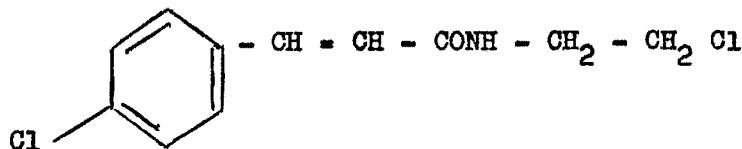
	μ OH - NH	3.300 cm <sup>-1</sup>
	μ CO	1.660 cm <sup>-1</sup>
	δ CH de CH = CH trans	975 cm <sup>-1</sup>
10	2 H adyacentes sobre el fenilo	820 cm <sup>-1</sup>

Ejemplo 4. N-(cloro-2-etil)-para-cloro-cinamamida.



P.M. = 244,12

15



20

Siguiendo las condiciones del ejemplo 2, a partir de 13 g ( $\frac{0,575 \text{ moles}}{10}$ ) de N(hidroxi-2-etil)-para-clorocinamamida, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de agujas amarillas en dicloroetano y funde a 144-146°C en tubo capilar.

Análisis ponderal

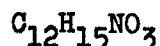
	C%	H%	N%	Cl%
25 Calculado	54,11	4,54	5,74	29,05
Encontrado	54,15	4,69	5,80	28,93

Espectro de infrarrojos. (K Br)

	μ NH	3.280 cm <sup>-1</sup>
	μ CO	1.660 cm <sup>-1</sup>
	δ CH de CH = CH trans	970 cm <sup>-1</sup>
30	2 H adyacentes sobre el fenilo	820 cm <sup>-1</sup>

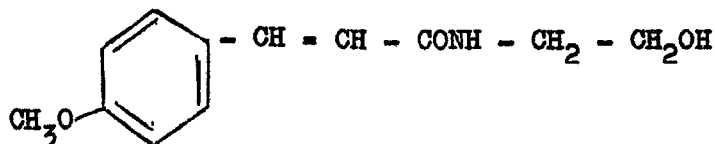


Ejemplo 5. N-(hidroxi-2-etil)-para-metoxi-cinamamida.



P.M. = 221,25

5



10

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 16,3 g (moles/10) de cloruro del ácido para-metoxicinámico, se obtiene un producto que cristaliza en acetato de etilo bajo forma de finas lentejuelas blancas y funde a 122-124°C en tubo capilar.

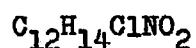
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	
15	Calculado	65,14	6,84	6,33
	Encontrado	65,21	6,65	6,22

Espectro de infrarrojos (K Br)

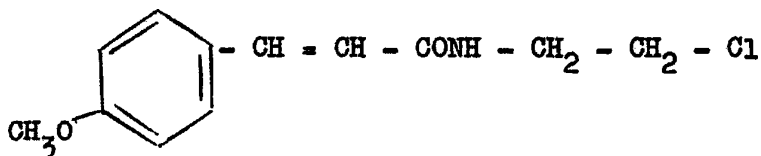
	$\nu$ OH - NH	3.420 $cm^{-1}$	- 3.300 $cm^{-1}$
	$\nu$ CO		1.650 $cm^{-1}$
20	$\delta$ CH de CH = CH trans		975 $cm^{-1}$
	2 H adyacentes sobre el fenilo		820 $cm^{-1}$

Ejemplo 6. N-(cloro-2-etil)-para-metoxi-cinamamida.



P.M. = 239,70

25



30

Siguiendo las condiciones operatorias del Ejemplo 2, a partir de 11,1 g ( $\frac{0,5 \text{ moles}}{10}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)-para-metoxi-cinamamida, se obtiene un producto que crist

378019



liza en dicloroetano bajo forma de muy pequeñas lentejuelas de color canela, y funde a 127-128°C en tubo capilar.

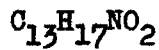
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	Cl%
5 Calculado	60,12	5,89	5,84	14,79
Encontrado	60,30	5,71	5,76	14,61

Espectro de infrarrojos. (K Br)

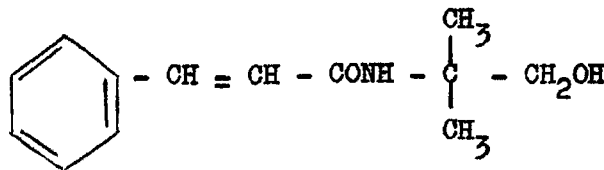
	$\mu$ NH	3.240 $\text{cm}^{-1}$
	$\mu$ CO	1.655 $\text{cm}^{-1}$
10 $\delta$ CH de CH = CH trans		980 $\text{cm}^{-1}$
	2 H adyacentes sobre el fenilo	822 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 7. N-[(hidroxi-2-dimetil-1,1)-etil]-cinamamida.



P.M. = 219,28

15



20

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1 a partir de 25,2 g (0,15 moles) de cloruro de cinamoilo, 13,5 g (0,15 moles) de metil-2-amino-2-propanol-1, 12,6 g (0,15 moles) de bicarbonato de sodio, se obtiene un producto que cristaliza en acetato de etilo bajo forma de finas agujas blancas y funde a 132-134°C en tubo capilar.

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
25 Calculado	71,20	7,82	6,39
Encontrado	71,35	8,00	6,53

Espectro de infrarrojos (K Br)

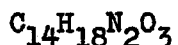
	$\mu$ OH - NH	3.290 $\text{cm}^{-1}$
	$\mu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
30 $\delta$ CH de CH = CH trans		980 $\text{cm}^{-1}$

5 H adyacentes sobre el fenilo

770 - 715  $\text{cm}^{-1}$

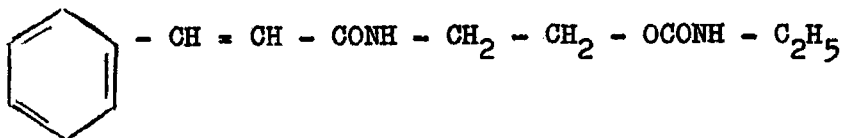


Ejemplo 8. N-(N-etil-etoxi-carbonil)cinamamida.



P.M. = 262,30

5



10

A 3,8 g ( $\frac{\text{moles}}{50}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)-cinamamida, se añaden 20 g de isocianato de etilo. Se calienta y, a la temperatura de ebullición, el alcohol pasa a solución y aparece, después de una decena de minutos de reflujo, un precipitado blanco. Se destila el isocianato de etilo en exceso. Se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de polvo blanco en dicloroetano. Rendimiento del orden de 90%.

15

P. de f. = 148,5-150,5°C (en tubo capilar).

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	64,10	6,92	10,68
Encontrado	63,93	7,02	10,80

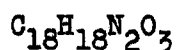
20

Espectro de infrarrojos (K Br)

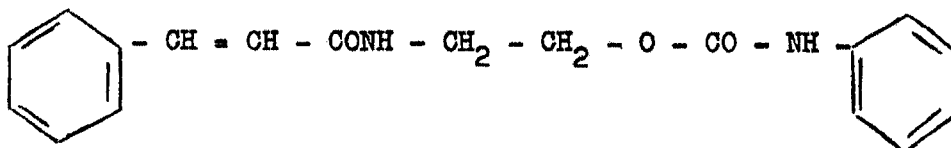
$\nu$ NH	3.320 $\text{cm}^{-1}$	-	3.240 $\text{cm}^{-1}$
$\nu$ CO	1.695 $\text{cm}^{-1}$	-	1.660 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	965 $\text{cm}^{-1}$		
5 H adyacentes sobre fenilo	780 $\text{cm}^{-1}$	-	740 $\text{cm}^{-1}$

25

Ejemplo 9. N-(N-fenil-etoxi-carbamil) cinamamida



P.M. = 310,34



30

Siguiendo las condiciones operatorias del Ejem-



plo 8, se tratan 1,9 g ( $\frac{\text{moles}}{100}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)cina-  
 mamida y 1,4 g ( $\frac{\text{moles}}{100}$ ) de isocianato de fenilo, a los que  
 se añaden 15 ml de tetracloruro de carbono para homogenei-  
 zar, entibiando bajo agitación y, después de reposo, se fil-  
 tra con succión el precipitado. Se obtiene un producto que  
 cristaliza bajo forma de lentejuelas blancas en dicloroeta-  
 no, de punto de fusión P. de f. = 152-154°C (en tubo capi-  
 lar).

Análisis ponderal

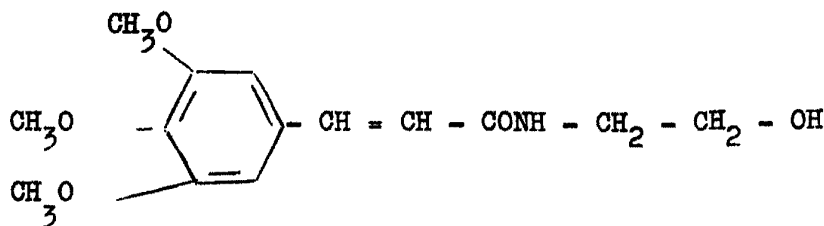
	C%	H%	N%
Calculado	69,66	5,85	9,03
Encontrado	69,63	5,86	9,16

Espectro de infrarrojos (K Br)

μ NH	3.300 $\text{cm}^{-1}$
μ CO	1.725 $\text{cm}^{-1}$ - 1.660 $\text{cm}^{-1}$
δ CH de CH = CH trans	975 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	770 $\text{cm}^{-1}$ - 725 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 10. N-(hidroxi-2-etil)-trimetoxi-3,4,5-  
cinamamida.

$\text{C}_{14}\text{H}_{19}\text{N O}_5$  P.M. = 281,30



Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a par-  
 tir de 4,8 g ( $\frac{\text{moles}}{50}$ ) de ácido trimetoxi-3,4,5-cinámico,  
 transformado en cloruro de ácido utilizado bajo forma bru-  
 ta, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de fi-  
 nas agujas blancas en dicloroetano y funde a 133-134°C en  
 tubo capilar.



28

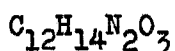
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	59.77	6,80	4,98
Encontrado	59,82	6,64	5,08

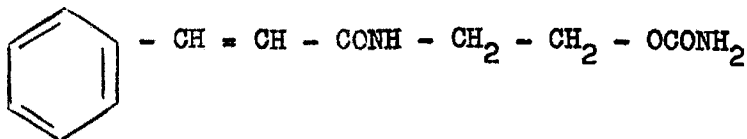
5 Espectro de infrarrojos (K Br)

$\mu$ OH - NH	3.430 $\text{cm}^{-1}$ - 3.320 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	965 $\text{cm}^{-1}$
1 H adyacente sobre fenilo	865 $\text{cm}^{-1}$

10 Ejemplo 11. N-(N-etoxicarbamil)-cinamamida.



P.M. = 234,25



15 A 90 ml ( $\frac{1,8 \text{ moles}}{10}$ ) de solución toluénica de fog  
 geno, se añaden 19,1 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)-cina-  
 mamida en solución en 200 ml de tetrahidrofurano y, a tem-  
 peratura inferior o igual a 7°C, se añaden 23,4 ( $\frac{1,8 \text{ moles}}{10}$ )  
 de quinoleína. Aparece un precipitado blanco. Se deja vol-  
 20 ver a la temperatura ambiente, se filtra con succión el  
 clorhidrato de quinoleína y se hace borbotear dentro del  
 filtrado gas amoniaco anhidro durante 2 horas. Se filtra  
 con succión el precipitado formado, se lava con agua y se  
 le reune con el filtrado orgánico que se ha concentrado.

25 El rendimiento es del orden de 60 a 70% de pro-  
 ducto que cristaliza en metanol bajo forma de lentejuelas  
 incoloras. P. de f. = 170-172°C (en tubo capilar).

30

378019



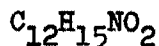
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	61,52	6,02	11,96
Encontrado	61,63	6,15	12,10

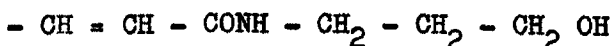
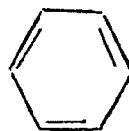
5 Espectro de infrarrojos (K Br)

- μ NH 3.410 cm<sup>-1</sup> - 3.315 - 3.285 - 3.210 cm<sup>-1</sup>
- μ CO 1.700 cm<sup>-1</sup> - 1.680 cm<sup>-1</sup>
- δ CH de CH = CH trans 970 cm<sup>-1</sup>
- 5 H adyacentes sobre el fenilo 725 cm<sup>-1</sup> - 765 cm<sup>-1</sup>

10 Ejemplo 12. N-(hidroxi-3-propil)-cinamamida.



P.M. = 205,25



15 Siguiendo las condiciones operatorias del Ejemplo 1, a partir de 16,7 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de cinamoilo y 30 g ( $\frac{4 \text{ moles}}{10}$ ) de amino-3-propanol-1, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de escamas blancas en dicloroetano. P. de f. = 82-84°C (en tubo capilar).

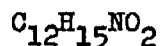
20 Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,36	7,48	6,96

Espectro de infrarrojos (K Br)

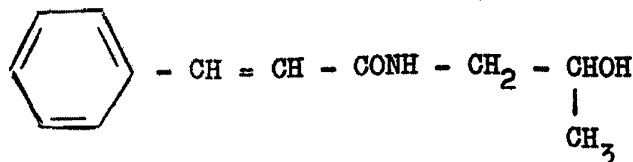
- μ OH - NH 3.400 - 3.290 cm<sup>-1</sup>
- 25 μ CO 1.650 cm<sup>-1</sup>
- δ CH de CH = CH trans 970 cm<sup>-1</sup>
- 5 H adyacentes sobre el fenilo 765 cm<sup>-1</sup> - 725 cm<sup>-1</sup>

Ejemplo 13. N-(hidroxi-2-propil-1)-cinamamida.



P.M. = 205,25

30



5 Siguiendo las condiciones operatorias del Ejemplo 1, a partir de 13,4 g ( $\frac{\text{moles}}{12,5}$ ) de cloruro de cinamoilo y 24 g ( $\frac{4 \text{ moles}}{12,5}$ ) de amino-1-propanol-2, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de polvo blanco en dicloroetano. P. de f. = 133-135°C. (en tubo capilar).

Análisis ponderal

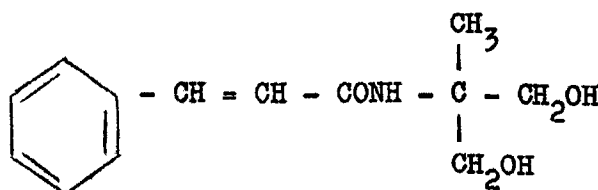
	C%	H%	N%
10 Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,40	7,32	6,87

Espectro de infrarrojos (K Br)

15 $\mu$ OH - NH	3.370 $\text{cm}^{-1}$ - 3.300 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	980 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	765 $\text{cm}^{-1}$ - 715 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 14. N-(dihidroxi-1,3-metil-2-propil-2)-cinamamida.

20  $\text{C}_{13}\text{H}_{17}\text{NO}_3$  P.M. = 235,28



25 Siguiendo las condiciones operatorias del Ejemplo 1, a partir de 16,7 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de cinamoilo y 23 g ( $\frac{2 \text{ moles}}{10} + 10\%$ ) de amino-2-metil-2-propanodiol-1,3, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de polvo blanco en dicloroetano. P. de f. = 105-107°C (en tubo capilar).

30

378019



Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	66,36	7,28	5,96
Encontrado	66,46	7,44	5,97

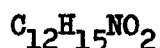
Espectro de infrarrojos (K Br)

5

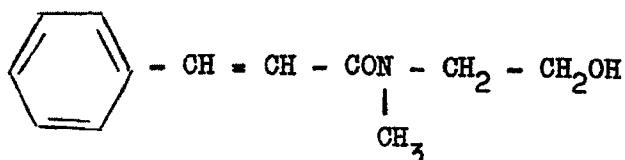
$\mu$ OH - NH	3.420 $\text{cm}^{-1}$ - 3.310 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	975 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	772 $\text{cm}^{-1}$ - 710 $\text{cm}^{-1}$

10

Ejemplo 15. N-metil-N-hidroxi-2-etil-cinamamida.



P.M. = 205,25



15

Siguiendo las condiciones del ejemplo 1, a partir de 16,7 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido cinámico y 16,5 g ( $\frac{2 \text{ moles}}{10} + 10\%$ ) de N-metil-N-hidroxi-etilamina, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de polvo blanco en dicloroetano. P. de f. = 79-81°C (en tubo capilar).

20

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,38	7,58	7,00

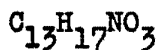
Espectro de infrarrojos (K Br)

25

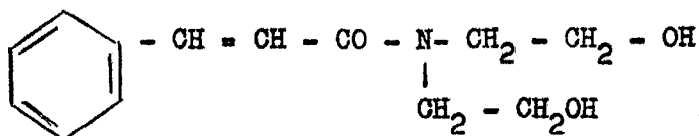
$\mu$ OH	3.350 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	980 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	765 $\text{cm}^{-1}$ - 705 $\text{cm}^{-1}$

30

Ejemplo 16. N,N-bis(hidroxi-2-etil)-cinamamida.



P.M. = 235,28



5

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 8,4 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de cinamoilo y 23 g ( $\frac{\text{moles}}{10} + 10\%$ ) de dietanolamina, se obtiene un producto que cristaliza en dicloroetano bajo forma de polvo blanco. P. de f. = 80-82°C (en tubo capilar).

10

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	66,36	7,28	5,96
Encontrado	66,56	7,45	6,08

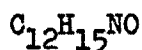
15

Espectro de infrarrojos (K Br)

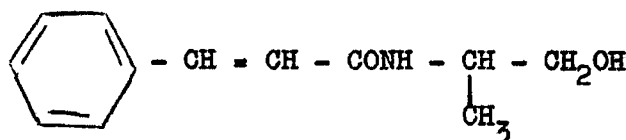
$\mu$ OH	3.300 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	972 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	770 $\text{cm}^{-1}$ - 710 $\text{cm}^{-1}$

20

Ejemplo 17. N-(hidroxi-1-propil-2)-cinamamida.



P.M. = 205,25



25

Siguiendo las condiciones del ejemplo 1, a partir de 8,4 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de cinamoilo, 3,8 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de alaninol y 4,2 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de bicarbonato de sodio, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pecueñas lentejuelas blancas en dicloroetano. P. de f. = 144-146°C (en tubo capilar).

30

378019



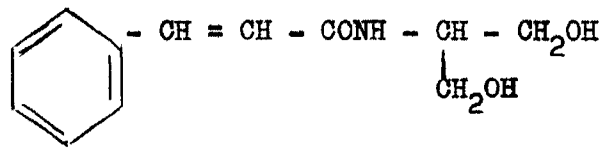
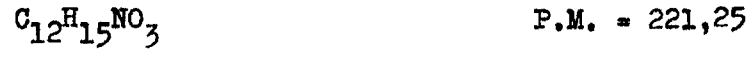
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,29	7,37	6,92

5 Espectro de infrarrojos (K Br)

$\nu$ OH - NH	3.300 $\text{cm}^{-1}$
$\nu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	985 $\text{cm}^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	775 $\text{cm}^{-1}$ - 735 $\text{cm}^{-1}$

10 Ejemplo 18. N-(dihidroxi-1,3-propil-2)-cinamamida.

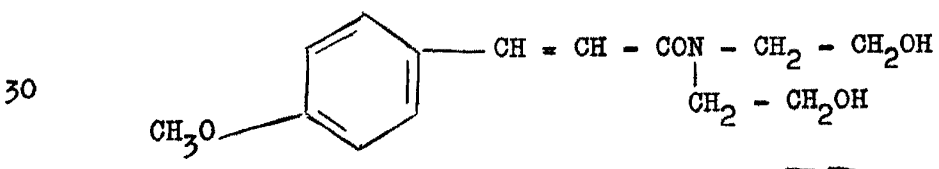


20 Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 6,5 g ( $\frac{0,3 \text{ moles}}{10}$  + 30%) de cloruro de cinamoilo, 2,7 g ( $\frac{0,3 \text{ moles}}{10}$ ) de serinol y 3,8 g ( $\frac{0,3 \text{ moles}}{10}$  + 50%) de bicarbonato de sodio, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeñas agujas blancas en dicloroetano. P. de f. = 125-126°C (en tubo capilar).

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	65,13	6,83	6,33
25 Encontrado	64,95	6,66	6,37

Ejemplo 19. N.N-bis(hidroxi-2-etil)-para-metoxi-cinamamida.





28

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 13,5 g ( $\frac{0.75 \text{ moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido para-metoxi-cinámico y 17,3 g ( $\frac{0.75 \text{ moles}}{10} + 10\%$ ) de dietanolamina, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de agujas blancas en dicloroetano. P. de f. = 95-96°C. (en tubo capilar).

5

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	63,39	7,22	5,28
Encontrado	63,19	7,37	5,15

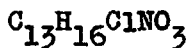
10

Espectro de infrarrojos (K Br)

- # OH 3.320  $\text{cm}^{-1}$
- # CO 1.650  $\text{cm}^{-1}$
- 6 CH de CH = CH trans 975  $\text{cm}^{-1}$
- 2 H adyacentes sobre el fenilo 820  $\text{cm}^{-1}$

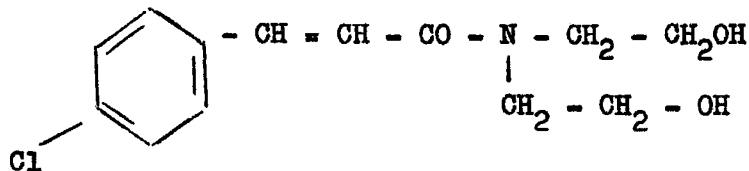
15

Ejemplo 20. N.N-bis(hidroxi-2-etil)-para-clorocinamamida.



P.M. = 269,73

20



25

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 14,6 g ( $\frac{0.72 \text{ moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido para-clorocinámico y 33 g ( $\frac{0.72 \text{ moles}}{5} + 10\%$ ) de dietanolamina, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de finas agujas blancas en dicloroetano. P. de f. = 129-131°C. (en tubo capilar).

30

378019



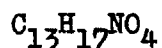
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	57,89	5,98	5,19	13,15
Encontrado	58,04	5,91	5,11	12,97

5 Espectro de infrarrojos (K Br)

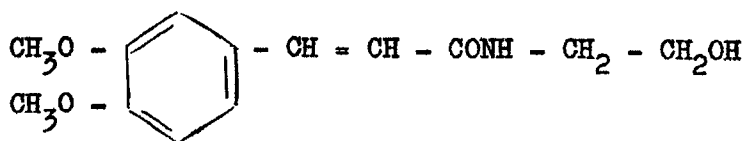
$\mu$ OH	3.320 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	975 $\text{cm}^{-1}$
2 H adyacentes sobre el fenilo	820 $\text{cm}^{-1}$

10 Ejemplo 21. N-(hidroxi-2-etil)-dimetoxi-3,4-cinamamida.



P.M. = 251,28

15



20

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 22,6 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro no purificado de ácido dimetoxi-3,4-cinámico, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeñas lentejuelas blancas en acetato de etilo. P. de f. = 122-123°C (en tubo capilar).

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	62,13	6,82	5,57
Encontrado	61,87	7,05	5,51

25

Espectro de infrarrojos (K Br)

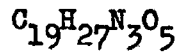
$\mu$ OH - NH	3.300 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	970 $\text{cm}^{-1}$
2 H adyacentes sobre el fenilo	815 $\text{cm}^{-1}$
1 H sobre el fenilo	865 $\text{cm}^{-1}$

30

1010-972

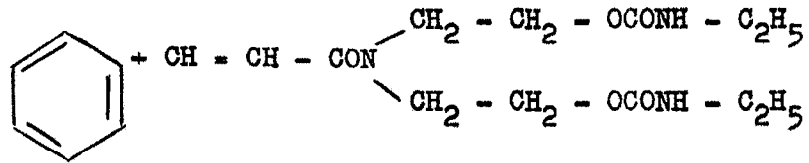


Ejemplo 22. N-bis(N-etiletotoxicarbamil)-cinamamida.



P.M. = 377,43

5



10

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 8, a partir de 12 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de N,N-bis-(hidroxi-2-etil)-cinamamida y 20 g de isocianato de etilo, se obtiene un producto que cristaliza en dicloroetano bajo forma de producto blanco algodonoso. P. de f. = 100-101°C (en tubo capilar).

Análisis ponderal

15

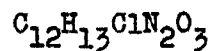
	C%	H%	N%
Calculado	60,47	7,21	11,14
Encontrado	60,64	7,43	11,61

Espectro de infrarrojos (K Br)

20

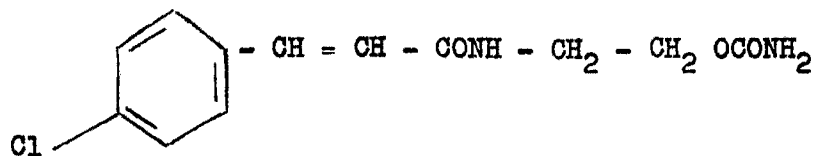
$\mu$ NH	3.320 $cm^{-1}$
$\mu$ CO	1.720 - 1.690 - 1.650 $cm^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	975 $cm^{-1}$
5 H adyacentes sobre el fenilo	767 $cm^{-1}$ - 710 $cm^{-1}$

Ejemplo 23. N-(N-etoxicarbamil)-para-cloro-cinamamida.



P.M. = 268,70

25



30

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 11, a partir de 8 g ( $\frac{0,35 \text{ moles}}{10}$ ) de N-(hidroxi-2-etil)-para-clorocinamamida, 200 ml de tetrahidrofurano, 35 ml ( $\frac{0,7 \text{ moles}}{10}$ ) de

21.3.70



solución toluénica de fosgeno y 11,5 g ( $\frac{0,35 \text{ moles}}{4}$ ) de quinoleína, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeñas agujas de aspecto algodonoso en metanol. P. de f. = 195-196°C.

5 Análisis ponderal

	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	53,63	4,88	10,43	13,19
Encontrado	53,77	4,85	10,31	13,04

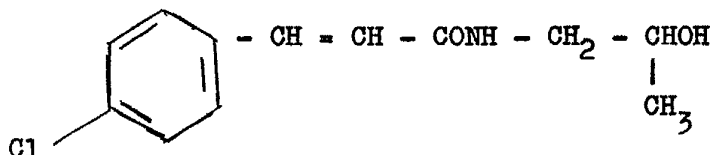
Espectro de infrarrojos (K Br)

10

$\mu$ NH	3.430 - 3.320 - 3.210 $\text{cm}^{-1}$
$\mu$ CO	1.700 - 1.680 $\text{cm}^{-1}$
$\delta$ CH de CH = CH trans	970 $\text{cm}^{-1}$
2 H adyacentes sobre el fenilo	822 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 24. N-(hidroxi-2-propil-1)-para-clorocinamamida.

15  $\text{C}_{12}\text{H}_{14}\text{ClNO}_2$  P.M. = 239,70



25 Siguiendo las condiciones operatorias del Ejemplo 1, a partir de 10,1 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de ácido para-clorocinámico y 18,7 g ( $\frac{\text{moles}}{4}$ ) de amino-1-propanol-2, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeñas agujas blancas en acetato de etilo y funde a 150-152°C en tubo capilar.

Análisis ponderal

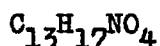
	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	60,12	5,89	5,84	14,79
30 Encontrado	60,30	5,98	5,67	14,76



Espectro de infrarrojos (K Br)

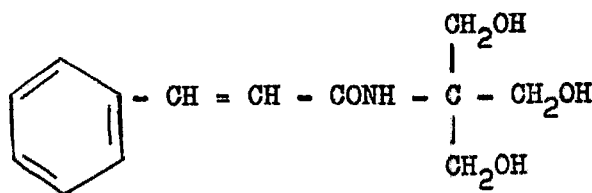
	μ OH - NH	3.300 cm <sup>-1</sup>
	μ CO	1.660 cm <sup>-1</sup>
	δ CH de CH = CH trans	990 cm <sup>-1</sup>
5	2 H adyacentes sobre el fenilo	825 cm <sup>-1</sup>

Ejemplo 25. N-[(bis-hidroximetil-1-hidroxi-2)etil]cinamamida.



P.M. = 251,28

10



15

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 16,7 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de cinamoilo, 30 ml de dioxano, 26,6 g ( $\frac{\text{moles}}{5} + 10\%$ ) de amino-2-hidroxi-metil-2-propanodiol-1,3 y 25 ml de agua, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeñas agujas de aspecto algodonoso en acetato de etilo y funde a 152-154°C en tubo capilar.

20

Análisis ponderal

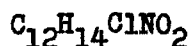
	C%	H%	N%
Calculado	62,13	6,82	5,58
Encontrado	62,25	6,96	5,55

Espectro de infrarrojos (K Br)

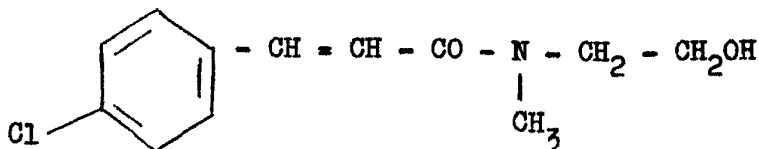
25	μ OH - NH	3.300 cm <sup>-1</sup>
	μ CO	1.660 cm <sup>-1</sup>
	δ CH de CH = CH trans	975 cm <sup>-1</sup>
	5 H adyacentes sobre el fenilo	770 cm <sup>-1</sup> - 715 cm <sup>-1</sup>

30

Ejemplo 26. N-metil-N-(hidroxi-2-etil)-paraclorocinamamida.



P.M. = 239,70



Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 10,1 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de ácido para-cloro-cinámico y 15 g ( $\frac{\text{moles}}{5}$ ) de N-metil-amino-2-etanol, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de cristales blancos en acetato de etilo. P. de f. = 113-115°C en tubo capilar.

Análisis ponderal

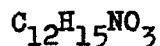
	C%	H%	N%	Cl%
Calculado	60,12	5,89	5,84	14,79
Encontrado	60,28	6,00	5,65	14,77

Espectro de infrarrojos (K Br)

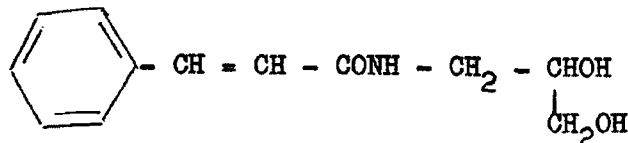
15

ν OH	3.350 $\text{cm}^{-1}$
ν CO	1.650 $\text{cm}^{-1}$
δ CH de CH = CH trans	980 $\text{cm}^{-1}$
2 H adyacentes sobre el fenilo	815 $\text{cm}^{-1}$

20 Ejemplo 27. N-[(dihidroxi-2,3)propil-1] cinamida.



P.M. = 221,25



Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 8,4 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de cinamoilo y 10 g ( $\frac{\text{moles}}{10} + 10\%$ ) de amino-3-propanodiol-1,2, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de pequeños granos blancos en diclo-



roetano y funde a 85-87°C en tubo capilar.

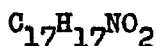
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	65,13	6,83	6,33
5 Encontrado	65,06	6,84	6,24

Espectro de infrarrojos (K Br)

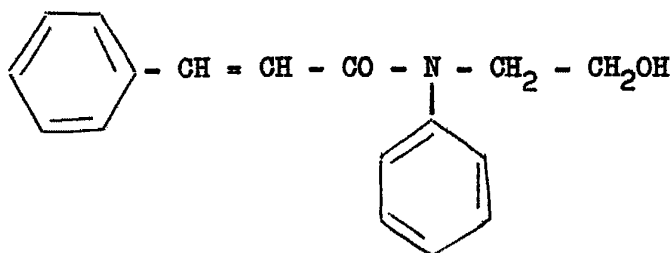
μ OH - NH	3.300 cm <sup>-1</sup>	(ancho)
μ CO	1.665 cm <sup>-1</sup>	
δ CH de CH = CH trans	970 cm <sup>-1</sup> - 980 cm <sup>-1</sup>	
10 5 H adyacentes sobre el fenilo	755 cm <sup>-1</sup> - 700 cm <sup>-1</sup>	

Ejemplo 28. N-fenil-N-(hidroxi-2-etil)-cinamamida.



P.M. = 267,32

15



20

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 8,4 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de cinamoilo y 15 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$  + 10%) de N-(hidroxi-2-etil)-anilina, se obtiene un producto que cristaliza en una mezcla de acetato de etilo-hexano (3/1) bajo forma de pequeñas escamas blancas y que funde a 73,5-74,5°C en tubo capilar.

25

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	76,38	6,41	5,24
Encontrado	76,38	6,48	5,12

Espectro de infrarrojos (K Br)

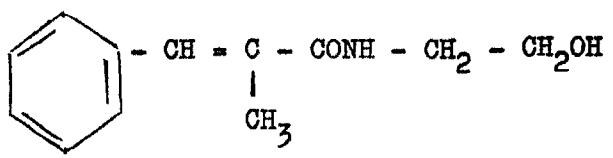
μ OH	3.440 cm <sup>-1</sup>
30 μ CO	1.650 cm <sup>-1</sup>



$\delta$  CH de CH = CH trans  $970 \text{ cm}^{-1}$   
 5 H adyacentes sobre el fenilo  $765 \text{ cm}^{-1} - 708 \text{ cm}^{-1}$

Ejemplo 29. N-(hidroxi-2-etil)-alfa-metil-cinamida.

5  $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{NO}_2$  P.M. = 205,25



10 Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 15 g ( $\frac{\text{moles}}{10} + 25\%$ ) de etanolamina en 15 ml de dioxano y 9,05 g ( $\frac{\text{moles}}{20}$ ) de cloruro de ácido metil-cinámico en 25 ml de dioxano, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de producto blanco algodonoso en acetato de etilo y funde a 107-109°C en tubo capilar.

Análisis ponderal

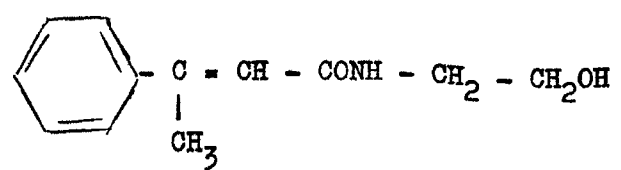
	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,38	7,44	6,90

Espectro de infrarrojos (K Br)

20  $\mu$  OH - NH  $3.300 \text{ cm}^{-1}$   
 $\mu$  CO  $1.650 \text{ cm}^{-1}$   
 5 H adyacentes sobre el fenilo  $750 \text{ cm}^{-1} - 705 \text{ cm}^{-1}$

Ejemplo 30. N-(hidroxi-2-etil)-beta-metil-cinamida.

25  $\text{C}_{12}\text{H}_{15}\text{NO}_2$  P.M. = 205,25



30



Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1 a partir de 3,6 g ( $\frac{2 \text{ moles}}{100}$ ) de cloruro de ácido-beta-metil-cinámico (no purificado) y 10 g de etanolamina, se obtiene un producto que cristaliza en dicloroetano bajo forma de cristales blancos y funde a 75-76°C en tubo capilar.

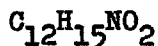
Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,11	7,37	6,93

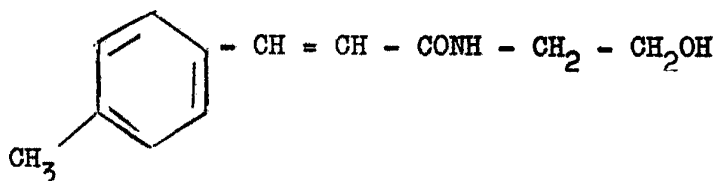
Espectro de infrarrojos (K Br)

μ OH - NH 3.270 cm<sup>-1</sup> - 3.360 cm<sup>-1</sup>  
 μ CO 1.660 cm<sup>-1</sup>  
 5 H adyacentes sobre el fenilo 770 cm<sup>-1</sup> - 700 cm<sup>-1</sup>

Ejemplo 31. N-(hidroxi-2-etil)-para-metil-cinamida.



P.M. = 205,25



Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 18 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido para-metil-cinámico y 30 g de etanolamina, se obtiene un producto que cristaliza bajo forma de bellas agujas incoloras en acetato de etilo, que funde a 107-108°C.

Análisis ponderal

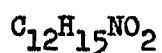
	C%	H%	N%
Calculado	70,21	7,37	6,83
Encontrado	70,33	7,45	6,92



Espectro de infrarrojos (K Br)

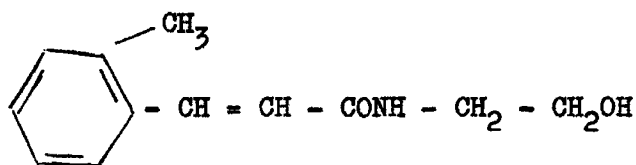
	$\mu$ OH - NH	3.300 $\text{cm}^{-1}$
	$\mu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
	$\delta$ CH de CH = CH trans	980 $\text{cm}^{-1}$ - 1.000 $\text{cm}^{-1}$
5	2 H adyacentes sobre el fenilo	815 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 32. N-(hidroxi-2-etil)-orto-metil-cinamida.



P.M. = 205,25

10



15

Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1 a partir de 18 g ( $\frac{\text{moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido orto-metil-cinámico y 30 g de etanolamina, se obtiene un producto que cristaliza en acetato de etilo bajo forma de cristales blancos y funde a 120-122°C en tubo capilar.

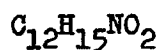
Análisis ponderal

	C%	H%	N%	
20	Calculado	70,21	7,37	6,83
	Encontrado	70,06	7,20	6,86

Espectro de infrarrojos (K Br)

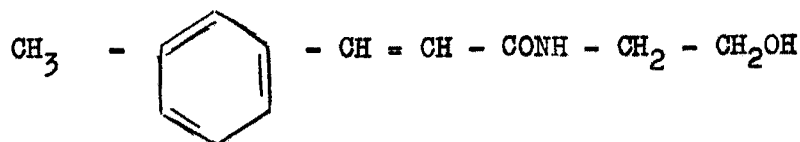
	$\mu$ OH - NH	3.320 $\text{cm}^{-1}$
	$\mu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$
25	$\delta$ CH de CH = CH trans.	980 $\text{cm}^{-1}$
	4 H adyacentes sobre el fenilo	765 $\text{cm}^{-1}$

Ejemplo 33. N-(hidroxi-2-etil)-meta-metil-cinamida.



P.M. = 205,25

30



5 Siguiendo las condiciones del Ejemplo 1, a partir de 15,3 g ( $\frac{0,85 \text{ moles}}{10}$ ) de cloruro de ácido meta-metil-cinámico y 26 g ( $\frac{0,425 \text{ moles}}{10}$ ) de etanolamina, se obtiene un producto que cristaliza en dicloroetano bajo forma de cristales blancos de monohidrato. P. de F. = 80-82°C en tubo capilar.

10 Valoración de agua

Calculado 8,07 %

Encontrado 8,13 %

Análisis ponderal

	C%	H%	N%
Calculado	64,54	7,68	6,27
15 Encontrado	64,79	7,63	6,37

Espectro de infrarrojos (K Br)

$\nu$ OH - NH	3.450 $\text{cm}^{-1}$	-	3.260 $\text{cm}^{-1}$
$\nu$ CO	1.660 $\text{cm}^{-1}$		
$\delta$ CH de CH = CH trans	970 $\text{cm}^{-1}$		
20 3 H adyacentes sobre el fenilo	780 $\text{cm}^{-1}$		

La presente solicitud, que corresponde a la presentada en Francia, el 2 de Abril de 1.969, bajo el Nº E.N. 6910054, se acoge a los beneficios del Artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

25

REIVINDICACIONES

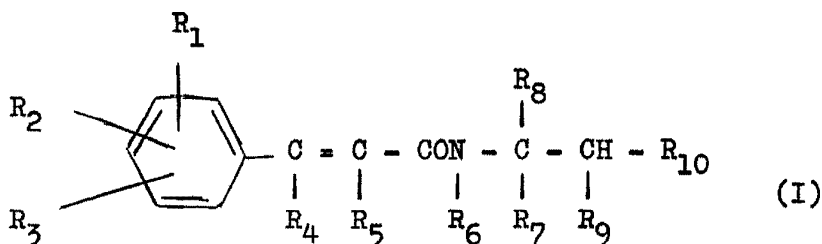
30 Los puntos de invención, propia y nueva, que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Paten-



te de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

1. Procedimiento de preparación de cinamamidas representadas por la fórmula

5



10

en la cual  $R_1$  y  $R_3$  son cada uno hidrógeno, un radical alcohilo inferior o alcoxi inferior;  $R_2$  es hidrógeno, un halógeno, un radical alcohilo inferior o alcoxi inferior;  $R_4$  y  $R_5$  son cada uno hidrógeno o un radical alcohilo inferior;  $R_6$  es hidrógeno, un radical alcohilo inferior, hidroxialcohilo inferior, arilo o alcohilo inferior -  $\text{NHCOO} - \text{C}_2\text{H}_4$ ;

15

$R_7$  y  $R_8$  son cada uno hidrógeno, un radical alcohilo inferior o hidroxialcohilo inferior;  $R_9$  es hidrógeno, un radical alcohilo inferior o hidroxialcohilo inferior;  $R_{10}$  es un halógeno, un radical hidroxil - salvo cuando  $R_1, R_2, R_3, R_4,$

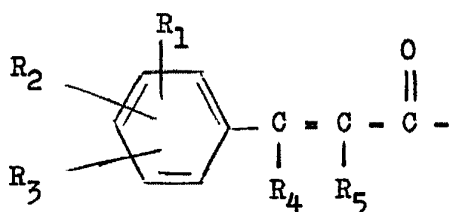
20

$R_5, R_6, R_7, R_8$  y  $R_9$  son hidrógeno y  $R_1, R_2, R_3$  son un radical metoxi,  $R_4$  es el radical metilo y  $R_5$  a  $R_9$  son hidrógeno - un radical hidroxialcohilo inferior,  $\text{NH}_2\text{-COO}$ , alcohilo inferior -  $\text{NHCOO}$  y aril -  $\text{NHCOO}$  -, caracterizado porque, cuando  $R_{10}$  es un radical hidroxil, hidroxialcohilo inferior,

25

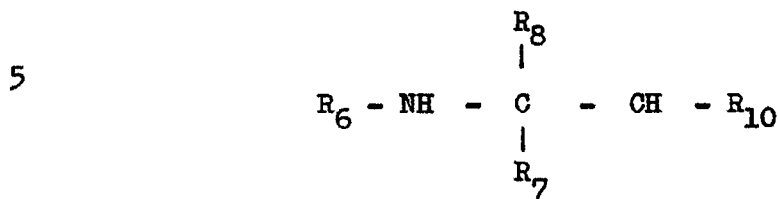
se hace reaccionar un derivado de un ácido cinámico, tal como un cloruro de ácido, un anhídrido de ácido o un éster, capaz de proporcionar el grupo

30

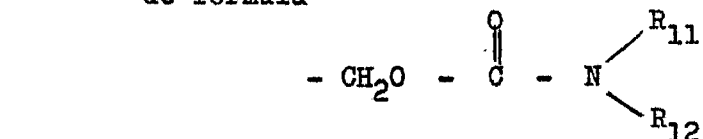




en cuya fórmula  $R_1, R_2, R_3, R_4$  y  $R_5$  tienen los mismos significados que precedentemente, con una hidroxialcoholamina de fórmula (III)



10 en la cual  $R_6, R_7, R_8$  y  $R_9$  tienen los mismos significados que precedentemente, y  $R_{10}$  es un radical hidroxilo inferior o hidroxialcohol inferior, cuando  $R_{10}$  es un halógeno, se hace reaccionar un alcohol de fórmula (I) con un reactivo halogenado tal como cloruro de tionilo, y cuando  $R_{10}$  es un radical de un grupo carbamato, caracterizado porque se transforman los alcoholes según la fórmula I en car-  
15 bamatos por medio de un agente de acilación del tipo ácido carbámico capaz de transformar un grupo  $CH_2OH$  en un grupo de fórmula



en la cual  $R_{11}$  y  $R_{12}$  son cada uno un átomo de hidrógeno o un radical alcohol inferior o arilo.

2. Procedimiento según la reivindicación 1, cuando  $R_{10}$  es un radical de grupo carbamato, caracterizado porque se hace reaccionar un alcohol de fórmula (I) ( $R_{10} = OH$  ó hidroxialcohol) con un agente de fórmula  $R - \overset{\overset{O}{||}}{C} - X$ , en  
25 la cual R es un halógeno, un radical alcoxi o ariloxi, y X es un átomo de halógeno, y después se condensa el producto intermedio obtenido con amoníaco o con una amina de fórmula general  $HN \begin{matrix} / R_{11} \\ \backslash R_{12} \end{matrix}$  en la cual  $R_{11}$  y  $R_{12}$  tienen los mismos  
30



significados que precedentemente.

3. Procedimiento de preparación según la reivindicación 1, cuando  $R_{10}$  es un radical del grupo carbamato, caracterizado porque se hace reaccionar un alcohol de fórmula (I) ( $R_{10} = OH$  ó hidroxialcohilo), con un isocianato de alcohol o de arilo.

4. Procedimiento de preparación de cinamamidas.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede, y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de 33 hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 28 MAR. 1970

P.A.

Alberto de Euzkadi  
Por Poder

378019