

P.- 44.156

378312

REGISTRACION TECNICA  
REGISTRACION  
Leo AGI  
d R

Case 1/338

P 19 18 073.5

Memoria descriptiva

378312



para solicitar PATENTE DE INVENCION EN ESPAÑA por 20 años

a nombre de C.H. BOEHRINGER SOHN

entida / de nacionalidad alemana

con domicilio en Ingelheim am Rhein, República Federal  
Alemana

por: "PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE NUEVAS 5-ARIL-  
1H-1,5-BENZODIAZEPIN-2,4-DIONAS"

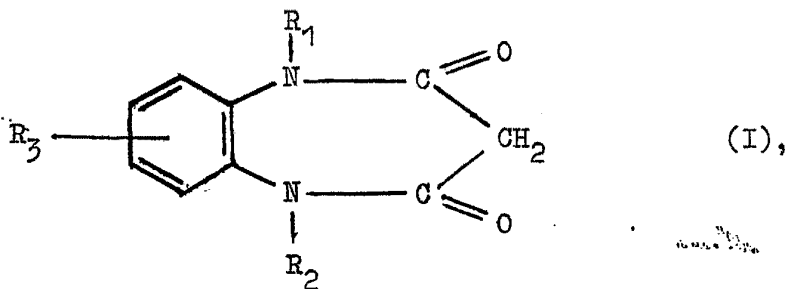
(Clase Internacional CO7d)

9.3.70.

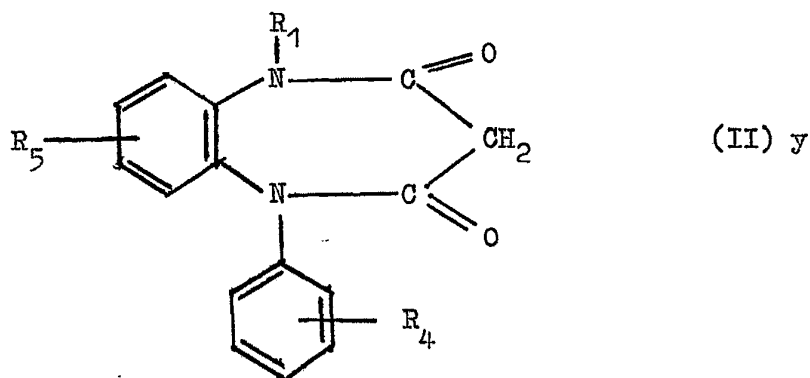


El invento concierne a un procedimiento para la preparación de nuevas 5-aryl-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-diona, que consisten en un grupo de compuestos de las fórmulas generales

5

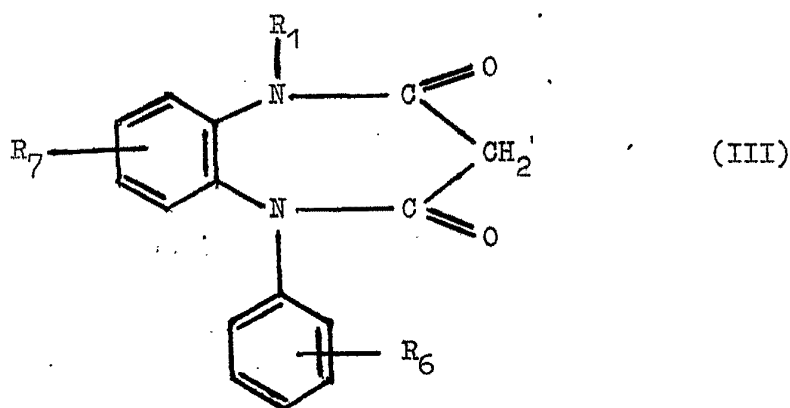


10



15

20



25

En estas fórmulas:

R<sub>1</sub> significa hidrógeno, un radical alcohilo recto o ramificado con 1 a 4 átomos de carbono, que está

30

9.3.70.



sustituído por un grupo hidroxilo o aciloxi, un grupo dial-  
cohilamino con 2 a 4 átomos de carbono, el radical alilo,  
el radical ciclohexilo, un radical fenilo, que eventual-  
mente puede estar sustituido de una a dos veces por el  
5 grupo metilo o metoxi o por un átomo de halógeno, o el  
radical bencilo;

$R_2$  significa el radical naftilo, pirimidinilo,  
tienilo o piridilo, pudiendo estar sustituido el último,  
eventualmente, por un grupo metilo o un átomo de halóge-  
no;  
10

$R_3$  significa hidrógeno, el grupo trifluorome-  
tilo o ciano, un átomo de halógeno o un grupo acilo o al-  
coxicarbonilo inferior con 1 ó 2 átomos de carbono;

$R_4$  significa hidrógeno, el grupo trifluorome-  
tilo, ciano o nitro, un átomo de halógeno o un grupo aci-  
lo o alcoxicarbonilo inferior;  
15

$R_5$  significa el grupo ciano o un grupo acilo  
o alcoxicarbonilo inferior;

$R_6$  significa el grupo ciano o nitro o un gru-  
po acilo o alcoxicarbonilo inferior;  
20

$R_7$  significa el grupo trifluorometilo o un  
átomo de halógeno.

Los nuevos compuestos pueden ser preparados  
por reacción de una 2-aminodifenilamina o 2-aminofenil-he-  
25 teroaril-amina adecuadamente sustituida con un dihalogenu-  
ro de ácido malónico, y en caso necesario por alcoholi-  
zación subsiguiente en posición 1.

La reacción tiene lugar preferiblemente uti-  
lizando un disolvente apropiado, tal como cloroformo, clo-  
30 ruro de metileno, benceno, tolueno, xileno, tetrahidrofufu-

9.3.70.

378312



remo, dioxano o dimetilformamida a temperaturas que, según los participantes en la reacción y el disolvente, se encuentran entre la temperatura ambiente y la temperatura de ebullición del disolvente utilizado en cada caso. En general, se ha mostrado como favorable para el transcurso de la reacción, la adición de una base orgánica terciaria, tal como piridina, trietilamina, etc.

Los productos finales, en los que el radical  $R_1$  significa hidrógeno, pueden ser alcoholados eventualmente de modo posterior con ayuda de agentes de alcoholación usuales, tales como un halogenuro de alcoholo o un éster alcoholico de ácido sulfúrico, por ejemplo sulfato de dialcoholo. Para este fin, se disuelve o suspende una sal alcalina de un compuesto no sustituido en posición 1 en un disolvente apropiado, se añade el agente de alcoholación y se calienta moderadamente la mezcla de reacción.

Se pueden lograr resultados especialmente favorables si se lleva a cabo la posterior alcoholación utilizando hidruro de sodio o amida de sodio.

Para la preparación de productos finales, en los que el radical  $R_1$  significa un grupo hidroxialcoholo, se puede citar además la reacción de un compuesto no sustituido en posición 1 con un óxido de alcoholeno en presencia de una base fuerte por ejemplo Triton B.

Si el radical  $R_1$  significa un grupo dialcoholaminoalcoholo, es posible introducir un doble enlace en el radical alcoholo por cuaternización y separación de trialcoholamina.

Además, en un producto final en el que  $R_1$  significa un radical alquenoilo, este radical puede ser hidro-

9.3.70.

378312



genado de manera de por sí conocida.

Las 2-aminodifenil-aminas o 2-aminofenil-heteroaril-aminas utilizadas como sustancias de partida pueden ser preparadas, según métodos usuales, por ejemplo por reducción catalítica de la correspondiente 2-nitrodifenil-amina o 2-nitro-fenil-heteroaril-amina. Las sustancias de partida, en las que R<sub>1</sub> significa un grupo alcohol, pueden obtenerse, análogamente a los datos indicados en Chemische Berichte, volumen 34, página 4204 (1902) y volumen 37, página 552 (1904), por cierre de anillo de una correspondiente amina con ácido fórmico, alcoholación en el átomo de nitrógeno mediante yoduro de alcohol y subsiguiente rotura o apertura del anillo con álcalis.

De acuerdo con el procedimiento precedentemente descrito, se pueden obtener por ejemplo los siguientes productos finales:

7-cloro-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(1-naftil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(2-tienil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(3-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-5-(5-cloropiridil-(2))-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(4-metilpiridil-(2))-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(2-nitrofenil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-5-(2-cianofenil)-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-5-(2-metoxicarbonilfenil)-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 5-(2-acetilfenil)-7-cloro-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-metoxicarbonil-1-metil-5-fenil-1H-

9.3.70.

378312



1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-metil-5-(2-piridil-7-trifluorometil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-bromo-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-metil-5-(2-pirimidinil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-ciano-1-metil-5-fenil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-etil-8-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-etil-7-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-etil-7-cloro-5-(3-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-n-propil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-butil-7-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-ciclohexil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-(beta-hidroxi-etil)-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-dimetilaminoetil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 8-cloro-1-fenil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 8-cloro-1-fenil-5-(2-tienil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-dimetilaminoetil-5-(2-nitrofenil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-bromo-5-(2-cianofenil)-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-bromo-1-metil-5-(2-nitrofenil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-metil-5-(2-nitrofenil)-7-trifluorometil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 5-(2-cianofenil)-1-metil-7-trifluorometil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 5-(2-cianofenil)-7-fluor-1-metil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-fluor-1-metil-5-(2-nitrofenil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-isopropil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-acetil-1-metil-5-fenil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-acetil-1-metil-5-fenil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona

9.3.70.

378312



pin-2,4-(3H,5H)-diona, 7-cloro-1-ciclohexil-5-(2-nitrofe-  
nil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-acetoxie-  
til-5-(2-nitrofenil)-7-trifluorometil-1H-1,5-benzodiaze-  
pin-2,4-(3H,5H)-diona, 1-acetoxietil-7-cloro-5-(2-piridil)-  
5 1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

Los nuevos compuestos de las fórmulas genera-  
les I, II y III poseen intensas propiedades psicosedantes  
y anticonvulsivas junto con una toxicidad en parte extraor-  
dinariamente pequeña. Como especialmente valiosos se han  
10 mostrado en este caso los compuestos en los que R<sub>1</sub> signi-  
fica un grupo alcoholo recto o ramificado con 1 a 4 átomos  
de carbono o una cadena alcoholo con 2 a 3 átomos de car-  
bono sustituido por un grupo hidroxilo, R<sub>2</sub> significa un ra-  
dical piridilo, y R<sub>3</sub> significa un átomo de halógeno o el  
15 grupo trifluorometilo o ciano en posición 7 de la molécula  
o R<sub>4</sub> significa un grupo trifluorometilo, nitro o ciano  
que se encuentra en posición orto, un átomo de halógeno o  
un grupo acilo o alcóxicarbonilo inferior, y R<sub>5</sub> significa  
el grupo ciano en posición 7 de la molécula, o R<sub>6</sub> signifi-  
20 ca el grupo ciano o nitro o un grupo acilo o alcóxicarbo-  
nilo inferior, y R<sub>7</sub> significa un átomo de halógeno o el  
grupo trifluorometilo en posición 7 de la molécula.

Los siguientes ejemplos deben explicar el in-  
vento con más detalle:

25 Ejemplo 1.- 7-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-ben-  
zodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,1 g de 2-(2-piridilamino)-4-clo-  
roanilina, de punto de fusión 83-85°C, son disueltos en 50  
ml de cloroformo y son mezclados a 50°C con 2 g de cloru-  
30 ro de malonilo. Se agita durante 3 a 4 horas, se vierte  
9.3.70.



sobre agua helada, se separa y se extrae por agitación con amoníaco diluido. La fase clorofórmica es secada, el disolvente es evaporado, y el residuo es recristalizado en cloruro de metileno/éter isopropílico.

5 Se obtiene el compuesto del título con p. de f. : 268-270°C.

Ejemplo 1a. 7-cloro-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

10 0,01 moles = 3 g de 7-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona, preparados de acuerdo con el Ejemplo 1, son suspendidos en 100 ml de tetrahidrofurano absoluto, y son agitados a la temperatura ambiente durante 2 horas con 0,6 g de dispersión de hidruro de sodio al 50% puro. Después se añaden a esto 3 ml de yodo de metilo y se calienta bajo agitación durante 6 horas a 70°C. La mezcla de reacción es concentrada por evaporación, el residuo es diluido con agua helada y es extraído por agitación con cloruro de metileno.

15 A partir de la solución lavada, secada y parcialmente concentrada por evaporación, se obtiene, después de añadir éter isopropílico, el compuesto del título. Este funde, después de recristalizar en etanol o isopropanol; a 232-235°C.

25 Ejemplo 1b: 7-cloro-1-beta-hidroxietil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

30 0,01 moles = 3 g de 7-cloro-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona son suspendidos en 500 ml de metanol y 25 ml de agua. Después de añadir 10 ml de óxido de etileno y 1 ml de Triton B, se agita durante 10 horas a la temperatura ambiente. Luego se concentra  
9.3.70.



7A

por evaporación la solución resultante, se recoge el residuo en cloruro de metileno, se extrae por agitación con agua, se seca y se evapora el disolvente. Después de recristalizar en etanol, se obtiene el producto final de p. de f. 176-178°C.

5

Ejemplo 2: 7-cloro-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,3 g de 2-(2-piridilamino)-4-cloro-N-metilanilina de p. de f. 115-117°C son disueltos en 50 ml de cloroformo y son mezclados con 1,8 g de trietilamina. La solución hirviente es mezclada con 2 g de cloruro de malonilo y es calentada bajo reflujo durante 3 horas. Después de tratar la mezcla de reacción análogamente al Ejemplo 1, se obtiene el compuesto del título de p. de f. 233-235°C.

10

15

Ejemplo 3: 7-bromo-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,8 g de 2-(2-piridilamino)-4-bromo-N-metilanilida de p. de f. 110-112°C son disueltos en 50 ml de cloruro de metileno. Después de añadir 2 ml de piperidina, se calienta a ebullición, se añaden gota a gota 2 g de cloruro de malonilo, y se calienta bajo reflujo durante 3 horas.

20

Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtiene la 7-bromo-1-metil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona de p. de f. : 197-198°C.

25

Ejemplo 4: 7-cloro-1-etil-5-(3-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,48 g de 2-(3-piridilamino)-4-cloro-N-etilanilina de p. de f. 88-89°C son disueltos en

30  
9.3.70.

378312



50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de cloruro de malonilo, y son agitados durante 3 horas a 50°C. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 196-198°C.

5                    Ejemplo 5: 7-cloro-1-metil-5-(5-cloropiridil-(2))-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,68 g de 2-(5-cloropiridil-(2)-amino)-4-cloro-N-metil-anilina de p. de f. = 117-119°C son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de cloruro de malonilo y son agitados a 50°C durante 3 horas. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 216-217°C.

10

Ejemplo 6: 7-cloro-1-metil-5-(2-pirimidinil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

15

0,01 moles = 2,35 g de 2-(2-pirimidinilamino)-4-cloro-N-metilanilina de p. de f. : 96-98°C son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de morfina y, después de añadir 2 g de cloruro de malonilo, son agitados durante 4 horas a una temperatura de 50°C.

20

Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 245-246°C.

Ejemplo 7: 1-etil-7-trifluorometil-5-(2-piridil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

25

0,01 moles = 2,8 g de 2-(2-piridilamino)-4-trifluorometil-N-etil-anilina de p. de f. : 125-127°C son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de cloruro de malonilo y son agitados durante 3 horas a 50°C. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 153-155°C.

30

Ejemplo 8. 1-bencil-7-cloro-5-(2-piridil)-1H-

9.3.70.

378312



37U

1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 3,1 g de 2-(2-piridilamino)-4-cloro-N-bencilanilina de p. de f. : 120-121°C son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de cloruro de malonilo y son agitados a 50°C durante 3 horas. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 216-218°C.

Ejemplo 9. 1-metil-5-(2-nitrofenil)-7-trifluorometil-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 3,1 g de 2-(2-nitrofenilamino)-4-trifluorometil-N-metilanilina de p. de f. : 110-111°C son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de cloruro de malonilo y son agitados a 50°C durante 3 horas. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 230-232°C.

Ejemplo 10: 7-cloro-1-metil-5-(2-tienil)-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-(3H,5H)-diona.

0,01 moles = 2,2 g de 2-(2-tienil)-4-cloro-N-metilanilina de p. de eb.  $0,5 = 148-150^{\circ}\text{C}$ , obtenida a partir del correspondiente acetato de p. de f. = 140-142°C, son disueltos en 50 ml de cloroformo, son mezclados con 2 g de piperidina y son agitados a 50°C durante 3 horas. Después de tratar análogamente al Ejemplo 1, se obtienen cristales incoloros de p. de f. : 173-174°C.

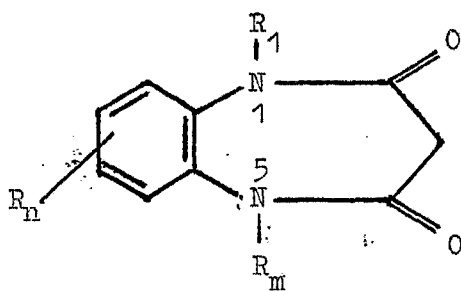
De acuerdo con el procedimiento explicado con más detalle por los ejemplos precedentes, se obtuvieron además los siguientes productos finales:

9.3.70.

378312



7A


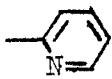






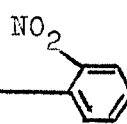
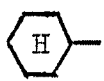
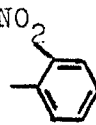



Ejemplo	R <sub>1</sub>	R <sub>m</sub>	R <sub>n</sub>	P. de f. oC.
11	CH <sub>3</sub>		7-Cl	209-211
12	CH <sub>3</sub>		7-Cl	164-166
13	CH <sub>3</sub>		7-Cl	225-277
14	CH <sub>3</sub>		7-Cl	206-208
15	CH <sub>3</sub>		7-Cl	209-210
16	CH <sub>3</sub>		7-Cl	183-184
17	CH <sub>3</sub>		7-Cl	205-206
18	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		7-Cl	177-178
19	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	7-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	145-157
20	-CH <sub>3</sub>		7-Cl	164-168
21	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		8-Cl	194-196
22	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		7-Cl	194-196

9.3.70.

378312



Ejemplo	R <sub>1</sub>	R <sub>m</sub>	R <sub>n</sub>	P. de f.
23	$-(\text{CH}_2)_3-\text{CH}_3$		7-Cl	148-149
24	$-\text{C}_6\text{H}_5$		8-Cl	203-204
25			7-Cl	190
26	$-\text{HC} \begin{cases} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{cases}$		7-Cl	165-167
27	$\text{CH}_3$	$\text{C}_6\text{H}_5$	7-COCH <sub>3</sub>	134-137
28	$\text{HO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2$		7-CF <sub>3</sub>	149-51
29	$\text{H}_3\text{C}-\text{CO}-\text{O}-\text{C}_2\text{H}_4$		7-Cl	196-198
30	H		7-CN	270-272
31	$\text{HO}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$		7-Cl	162-163
32			7-Cl	182-183
33	$\text{CH}_3-\text{CH}_2-$		7-Br	239-240

9.3.70.

378312



7A

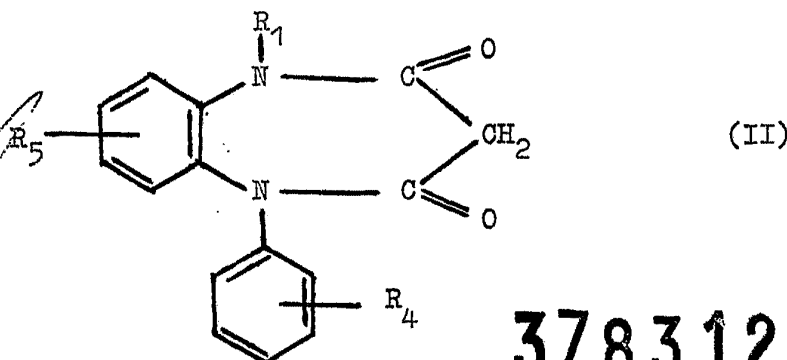
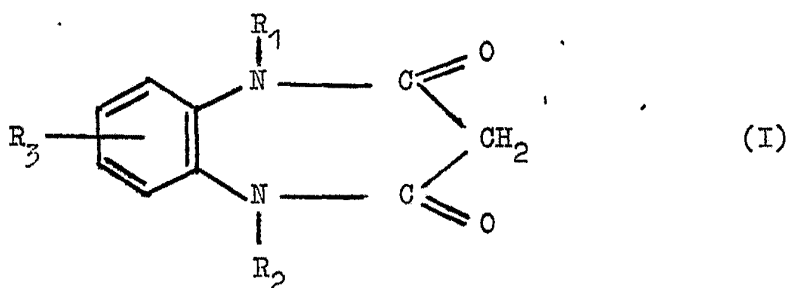
La presente solicitud que corresponde a la presentada en la República Federal Alemana, el 9 de Abril de 1.969, bajo el número P 19 18 073.5, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

REIVINDICACIONES

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

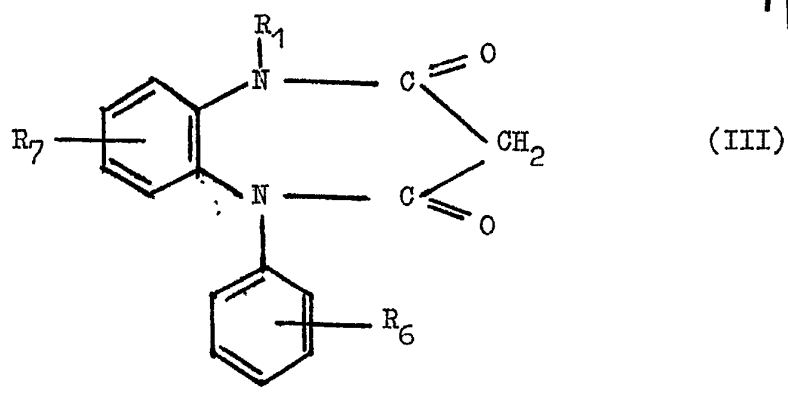
10

1.- Procedimiento para la preparación de nuevas 5-aril-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-dionas, que consisten en un grupo de compuestos de las fórmulas generales:



9.3.70

378312



en que  $R_1$  significa hidrógeno, un radical alcohilo recto  
 o ramificado con 1 a 4 átomos de carbono, que está susti-  
 tuído por un grupo hidroxilo o aciloxi, un grupo dialcohila  
 5      mino con 2 a 4 átomos de carbono, el radical alilo, el ra  
 dical ciclohexilo, un radical fenilo, que eventualmente  
 puede estar sustituido una o dos veces por el grupo metilo  
 o metoxi, o un átomo de halógeno, o el radical bencilo;  
 $R_2$  significa el radical naftilo, pirimidinilo, tienilo o  
 piridilo, pudiendo estar sustituido el último eventualmen  
 10      te por un grupo metilo o un átomo de halógeno;  $R_3$  signifi  
 ca hidrógeno, el grupo trifluorometilo o ciano, un átomo  
 de halógeno o un grupo acilo o alcoxicarbonilo inferior,  
 con 1 ó 2 átomos de carbono;  $R_4$  significa hidrógeno, el  
 grupo trifluorometilo, ciano o nítro, un átomo de halóge-  
 15      no o un grupo acilo o alcoxicarbonilo inferior;  $R_5$  signifi  
 ca el grupo ciano o un grupo acilo o alcoxicarbonilo in  
 ferior;  $R_6$  significa el grupo ciano o nitro o un grupo  
 acilo o alcoxicarbonilo inferior;  $R_7$  significa el grupo  
 trifluorometilo o un átomo de halógeno, caracterizado por  
 20      que se hace reaccionar una 2-aminodifenil-amina o 2-amino-  
 fenil-heteroaril-amina con un dihalogenuro de ácido maló-

9.3.70.



nico, y se alcohola el compuesto así obtenido, eventual-  
mente, en posición 1.

5 2.- Procedimiento según la reivindicación 1,  
caracterizado porque se lleva a cabo la reacción con ad-  
ción de una base orgánica terciaria.

3.- Procedimiento según la reivindicación 1,  
caracterizado porque se lleva a cabo una alcoholación pos-  
terior con utilización de hidruro de sodio o amida de so-  
dio.

10 4.- Procedimiento para la preparación de nue-  
vas 5-aril-1H-1,5-benzodiazepin-2,4-dionas.

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

15 Esta Memoria consta de dieciséis hojas escri-  
tas a máquina por una sola cara.

Madrid, 7 ABR. 1970

P. A.

For Foreign  
*Arta*

G.D.S.  
9.3.70.

378312