



P.- 53.868

FA/ml

Int. Cl.: C07D//A61K

MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar PATENTE DE INVENCION

por 20 años

a nombre de LABORATORIOS MADE, S.A.

entidad española

establecida en Avenida de Burgos, Km. 5,850, Madrid

por: "UN METODO PARA LA PRODUCCION INDUSTRIAL DE DERIVADOS
DE ANHIDRIDOS NAFTALICOS".

(Clase Internacional C07d)

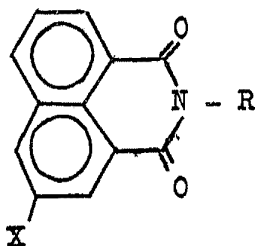
413419



El presente invento tiene por objeto la producción industrial de derivados de anhídridos naftálicos que presentan una marcada actividad farmacológica.

Estos compuestos tiene de fórmula general

5



10

donde R es un grupo aminoalquilo, o aminoarilo y X un H o un grupo nitro.

15

El método general de síntesis de estos compuestos está basado en la reacción de un anhídrido naftálico, con o sin sustituyente, con una alquil o arilhidrazina a reflujo, en el seno de un disolvente apropiado, aunque la naturaleza de éste no influya de gran manera en el proceso. Los productos cristalizan, se filtran y se purifican por recristalización en el seno de un disolvente adecuado.

20

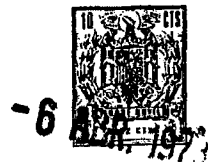
A continuación se exponen algunos ejemplos no limitativos del alcance del presente invento.

Ejemplo 1: (R = NH-CH₃; X = H).

25

Una mezcla de 5 g. (0,025 moles) de anhídrido

413419



naftálico y 2 g. de metilhidrazina disueltos en 100 c.c. de alcohol etílico, se calienta a reflujo durante dos horas. Al enfriar cristaliza un sólido rojizo que una vez filtrado a vacío, se cristaliza de etanol.

5 La N-aminometilnaftalimida es un sólido amarillo acicular de P.F. = 136-139°C.

Análisis:

Calculado para $C_{13}H_{10}N_2O_2$

C.- 69,00; H.- 4,68; N.- 13,38

10 Encontrado

C.- 68,79; H.- 4,70; N.- 12,09

Ejemplo 2: (R = NH-C₆H₅; X = H).

15 Una mezcla de 5 g. (0,025 moles) de anhídrido naftálico y 3,1 g. de fenilhidrazina disueltos en 100 ml. de alcohol etílico, se calienta a reflujo durante tres horas. Al cabo de cierto tiempo comienza a formarse un sólido parduzco. Una vez transcurrido el tiempo especificado, se deja enfriar y el sólido se filtra, cristalizándose a continuación en acético.

20 La N-aminofenilnaftalimida es un sólido amarillo-castaño de P.F. = 207-209°C.

Análisis:

Calculado para $C_{18}H_{12}N_2O_2$

25 C.- 74,98; H.- 4,19; N.- 9,71

13419

-5



Encontrado

C.- 74,73; H.- 4,22; N.- 9,73

Ejemplo 3: (R = NH-CH₃; X = NO₂).

5 Una mezcla de 4,8 g. (0,02 moles) de anhídrido 3-nitronaftálico y 1 g. de metilhidrazina disueltos en 100 ml. de alcohol etílico, se calienta a reflujo durante dos horas. Ya en caliente comienza a formarse un sólido amarillo que se filtra al enfriar, recristalizándose a continuación en ácido acético.

10 La N-metilamino-3-nitronaftalimida es un sólido amarillo de P.F. = 212-213°C.

Análisis:

Calculado para C₁₃H₉N₃O₄

C.- 57,56; H.- 3,34; N.- 15,49

15 Encontrado

C.- 57,47; H.- 3,46; N.- 15,37

Ejemplo 4: (R = NH-C₆H₅; X = NO₂).

20 Una mezcla de 6,1 g. (0,025 moles) de anhídrido 3-nitronaftálico y 2,7 g. (0,025 moles) de fenilhidrazina disueltos en 100 ml. de alcohol etílico, se calienta a reflujo durante dos horas. Ya en caliente comienza a precipitar un sólido amarillo que se filtra al enfriar, recristalizándose a continuación en ácido acético.

25 La N-fenilamino-3-nitronaftalimida es un sólido

413419



do amarillo de P.F. = 215-217°C.

Análisis:

Calculado para $C_{18}H_{11}N_3O_4$

C.- 64,86; H.- 3,32; N.- 12,60

5

Encontrado

C.- 65,16; H.- 3,55; N.- 12,71

10

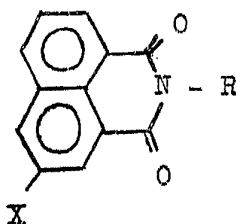
REIVINDICACIONES

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 que se recogen en las reivindicaciones siguientes:

15

1ª.- Un método para la producción industrial de derivados de anhídridos naftálicos de fórmula

20



donde R es un grupo aminoalquilo o aminoarilo y X un hidrógeno o un grupo nitro, caracterizado por la reacción de un anhídrido naftálico, con o sin sustituyente

25

413419



5 en la posición tres, con una alquil o arilhidrazina a reflujo, en el seno de un disolvente apropiado en el que productos cristalizan, se filtran y se purifican por recristalización en el seno de un disolvente adecuado.

2ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque el anhídrido que se utiliza es el naftálico.

10 3ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque el anhídrido que se utiliza es el 3-nitronaftálico.

4ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la alquilhidrazina que se utiliza es la metilhidrazina.

15 5ª.- Un método según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la arilhidrazina que se utiliza es la fenilhidrazina.

6ª.- Un método para la producción industrial de derivados de anhídridos naftálicos.

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

25

4.4.74

- 6 -

A handwritten signature in dark ink, consisting of several stylized, overlapping loops and a horizontal line at the bottom.

413419

18 APR 1974



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

Madrid, 18 APR 1974

P.A.

[Handwritten signature]
ALBERTO G. DE LA ROSA

4.4.74
MCM

- 7 -

[Handwritten signature]