

414707



PATENTE DE INVENCION

Ref. 2941-II

Int. Cl. C 07 C

Memoria Descriptiva

sobre:

PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE
BENZOPENONA

Solicitante:

CASSELLA FARBERWERKER MAINKUR AKTIENGESELLSCHAFT,
entidad alemana, residente en 6000 Frankfurt
(Main)-Fechenheim, Republica Federal Alemana.

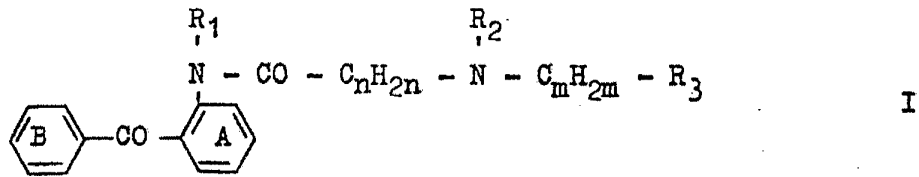
414707



- 1 -

La invención se refiere a un procedimiento para la obtención de nuevos derivados, farmacológicamente valiosos, de benzofenona, de fórmula general I

5.



10.

y de sus sales de adición de ácido, donde R_1 y R_2 significan hidrógeno o un resto alquilo saturado o insaturado con 1 a 4 átomos de carbono, R_3 significa el grupo $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{COOCH}_3$, $-\text{COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{COOH}$ ó $-\text{COOMe}$, donde Me representa un catión de metal, n significa los números 1 ó 2 y m significa los números 2 ó 3 y los núcleos A y B pueden estar sustituidos.

15.

El núcleo A puede estar sustituido en la posición 5 preferentemente por halógeno, especialmente cloro, nitro, trifluormetilo, metilo, metoxi o metilmercapto y el núcleo B en la posición 2' por fluor o cloro. Los restos R_1 y R_2 significan preferentemente hidrógeno y el grupo metilo, además, R_2 puede significar también preferentemente el grupo n-butilo. Para el catión de metal Me se da preferencia a los cationes de metal farmacológicamente compatibles, por ejemplo el ión de sodio, potasio, amonio o calcio.

25.

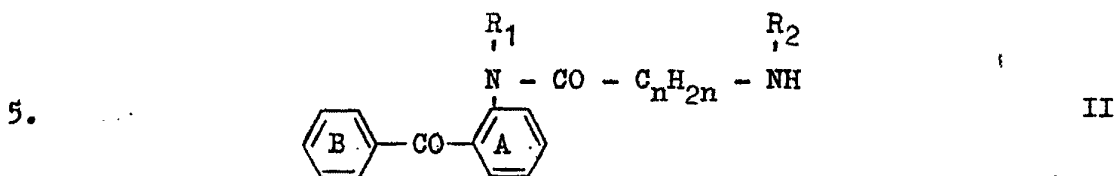
Los compuestos de la fórmula general I se obtienen,

414707

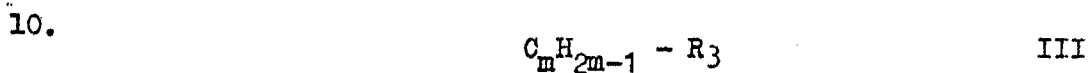


- 2 -

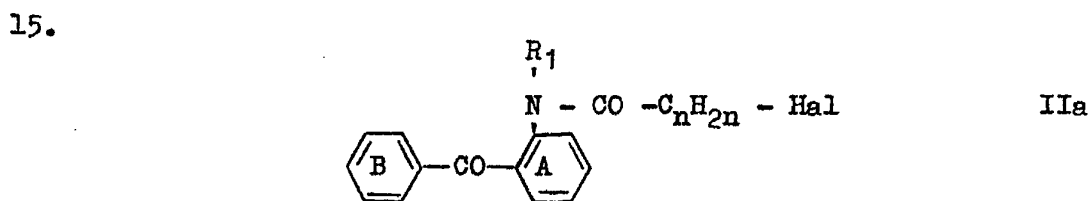
según la presente invención si un derivado benzofenónico de fórmula general II



se adosa a un compuesto que lleva un enlace doble alifático de fórmula general III



Los compuestos de partida de fórmula general II, se pueden obtener haciendo reaccionar un compuesto de fórmula general IIa



20. con una amina de fórmula general IV



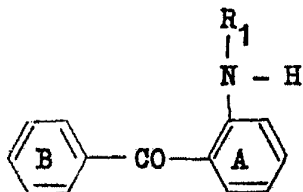
25. La reacción se efectúa preferentemente a una temperatura entre 5° y 50° con una duración de la reacción de pocas horas hasta varios días, ventajosamente en un disolvente ade-

-414707



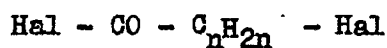
cuado.

Los compuestos de fórmula general IIIa se obtienen fácilmente de aminobenzofenonas de fórmula general V



V

5. por reacción con un haluro halogenoacílico de fórmula general VI



VI

10. La obtención según la presente invención de los compuestos de fórmula general I se efectúa preferentemente en un disolvente adecuado a temperatura ambiente o temperatura más elevada. Disolventes adecuados son, por ejemplo, los alcoholes, los éteres, las cetonas, los hidrocarburos y las amidas de ácido.

15. Los compuestos obtenibles según la presente invención en los cuales R_3 significa el grupo carbometoxi o carboetoxi se pueden transformar por saponificación en compuestos de la presente invención con $R_3 = \text{COOH}$ o por amonólisis en compuestos de la presente invención con $R_3 = \text{CONH}_2$.

20. Los compuestos obtenibles según la presente invención, en los cuales R_3 significa COOH , se pueden transformar en forma conocida en las sales correspondientes COOMe .



414707

- 4 -

Normalmente representan los compuestos obtenibles según la presente invención unas sustancias oleaginosas, que, en la forma usual, se pueden transformar en sales de adición de ácido cristalinas.

5. Los compuestos de fórmula general I y sus sales de aplicación farmacéutica se destacan por valiosas propiedades farmacológicas, especialmente por un destacado efecto amortiguador sobre el sistema nervioso central. Algunos de estos compuestos poseen también propiedades relajantes de los músculos e inhibidoras de la agresividad. Los compuestos de fórmula general I y sus sales de aplicación farmacéutica son, por lo tanto, valiosas sustancias medicinales que se pueden emplear como medicamentos tanto directamente como también en forma de sus sales farmacéuticamente compatibles.
- 10.
15. Los preparados farmacéuticos se pueden fabricar, por ejemplo, como tabletas, supositorios, cápsulas, emulsiones o suspensiones, en forma en sí conocida, mediante el empleo de excipientes farmacéuticos que no reaccionen con los compuestos. Como excipiente farmacéutico se puede emplear cualquier sustancia adecuada para el fin previsto, por ejemplo, talco, fécula, aceites vegetales, vaselina, etc. En caso dado, los preparados farmacéuticos pueden contener además otras sustancias terapéuticamente activas.
- 20.
25. La comprobación farmacológica del efecto amortiguador del sistema central (sedante) se efectuó a base del ensayo



414707

- 5 -

trepador con ratones albinos descrito por P.K. KNEIP: Arch. int. pharmacodyn 126, 238 (1960) y R. DOMENJOZ y W. THEOBALD: Arch. int. pharmacodyn 120, 450 (1959).

5. En la tabla a continuación se han resumido los resultados de los ensayos farmacológicos efectuados. En la última columna de la tabla se indica bajo del enunciado "Efecto inhibidor central en %" el porcentaje de los animales de ensayo que ya no inician el trabajo de trepar normalmente efectuado con ganas.

Preparado	LD50 g/kg raton	Dosis mg/kg p.o.	Efecto inhi- bidor central en %
2-(5-ciano-N,4-dimetil-3-aza-pentanamido)-5-cloro-benzofenona	0,315 i.p.	8	50
2-(5-ciano-3-aza-hexanamido)-5-cloro-benzofenona	0,6 i.p.	8	50
2-(5-ciano-N,3-dimetil-3-aza-hexanamido)-5-nitro-benzofenona	1,1 p.o. 0,48 i.p.	10	60
2-(5-ciano-N,4-dimetil-3-aza-pentanamido)-benzofenona	0,32 i.p.	8	70
2-(5-ciano-3-alil-3-aza-pentanamido)-2',5-dicloro-benzofenona	0,63 i.p.	8	60
2-(5-ciano-N-metil-3-n-butil-3-aza-pentanamido)-5-cloro-benzofenona	0,36 i.p.	8	80



414707

- 6 -

Preparado	LD50 g/kg ratón	Dosis mg/kg p.o.	Efecto inhi- bidor central en %
2-(5-ciano-N-metil-3-n- butil-3-aza-pentanamido) -5-nitro-benzofenona	0,68 i.p.	8	50
2-(5-ciano-N,4-dimetil- 3-aza-pentanamido)-5-me toxi-benzofenona	0,25 i.p.	8	60
2-(5-ciano-N,4-dimetil- 3-aza-pentanamido)-5-me til-benzofenona	0,3 i.p.	8	70
2-(5-ciano-N,3-dimetil- 3-aza-pentanamido)-5- cloro-benzofenona	0,24 i.p.	8	50
2-(5-ciano-N,3,4-trime- til-3-aza-pentanamido)- 5-cloro-benzofenona	0,32 i.p.	9	50
2-(5-ciano-N,3-dimetil- 3-aza-pentanamido)-5-ni tro-benzofenona	>1,0 p.o.	10	50
2-(5-ciano-4-metil-3- aza-pentanamido)-benzo- fenona	>1,0 p.o.	10	50
2-(6-ciano-3-metil-3- aza-hexanamido)-5-cloro- -benzofenona		8	60
2-(5-ciano-N-metil-3-aza -pentanamido)-5-metoxi- -benzofenona		8	50
2-(5-ciano-N-metil-3-aza -pentanamido)-5-metil- -benzofenona		8	50



- 7 - 414707

Preparado	LD50 g/kg ratón	Dosis mg/kg p.o.	Efecto inhi- bidor central en %
2-(5-etoxicarbonil-N- metil-3-aza-pentanami- do)-5-trifluormetil- -benzofenona	0,4 i.p.	8	60
2-(5-carboxi-3-metil- 3-aza-pentanamido)-5- cloro-benzofenona	0,45 i.p.	8	90
2-(6-etoxicarbonil-N- metil-3-aza-hexanami- do)-5-nitro-benzofeno na	0,65 i.p.	8	60
2-(6-etoxicarbonil-3- aza-hexanamido)-5-ni- tro-benzofenona		8	50
2-(5-etoxicarbonil-3- aza-pentanamido)-2',5 -dicloro-benzofenona		8	70
2-(5-etoxicarbonil-N- metil-3-aza-pentanami do)-5-metilmercapto- -benzofenona		8	60
2-(5-etoxicarbonil-N- metil-3-aza-pentanami do)-5-metil-benzofenona		8	50
Preparado comparativo:			
Meprobamato	0,62 i.p.	70	50

En el ejemplo a continuación se indican las tempera-
turas en grados centígrados. La abreviación "Z" en las in-
dicaciones de los puntos de fusión significa descomposición.
Como medio de sorpción para los cromatogramas de capa delga-

- 8 - 414707



da se empleó gel de sílice HF₂₅₄₊₃₆₆ (tipo 60) según Stahl.

Ejemplo

- Se disuelven 3,0 g de 2-(metilamino-acetamido)-5-cloro-benzofenona en 30 cc de alcohol anhidro y después se mezcla con 2,0 g de acrilnitrilo recién destilado. Se agita durante 2 horas a temperatura ambiente y a continuación se calienta durante otras 8 horas bajo reflujo. Después de reposar durante la noche a temperatura ambiente se agregan de nuevo 2,0 g de acrilnitrilo recién destilado y se calienta durante otras 4 horas bajo agitación al reflujo. Muestra entonces, una muestra tomada, en el cromatograma de capa delgada, un punto unitario que es distinto al del producto de partida. Se filtra la solución turbia y se concentra por evaporación en vacío (unos 0,1 Torr), con lo que se obtienen 3,0 g de un aceite incoloro. Se disuelve este residuo en dietiléter anhidro. Después de introducir gas clorhídrico secó en esta solución se obtienen 3,6 g de hidrocioruro de 2-(5-ciano-3-metil-3-aza-pentanamido)-5-cloro-benzofenona, lo que corresponde a un 92 % de la teoría. El producto muestra un p.f. de 166-168°. El calor Rf en el cromatograma de capa delgada en metanol como eluyente asciende a 0,85.

- En forma análoga se obtienen de 2-(metilamino-acetamido)-5-cloro-benzofenona y acrilato de etilo el hidrocioruro de 2-(5-etoxicarbonil-3-metil-3-aza-pentanamido)-5-cloro-benzofenona del p.f. 129 - 131° y de 2-(metilamino-acetamido)-



414707

- 9 -

-5-cloro-benzofenona y acrilamida el hidrocloreto de 2-(5-amidocarbonil-3-metil-3-aza-pentanamido)-5-cloro-benzofenona del p.f. 158 - 160°.

5. Se obtiene la 2-(metilamino-acetamido)-5-cloro-benzofenona, necesaria como producto de partida, de la manera siguiente:

10. Se mezcla una solución de 24,5 g de 2-(cloroacetamido)-5-cloro-benzofenona en 400 cc de dioxano anhidro con 150 cc de una solución al 15 % de metilamina en metanol y después se deja reposar durante la noche, a temperatura ambiente, en el recipiente cerrado. Se filtra la mezcla de reacción y el filtrado se concentra por evaporación a una temperatura del baño María de 25°, en vacío, y el residuo se reparte entre 630 cc de dietiléter y 700 cc de ácido clorhídrico 0,3-n.

15. Se vuelve a agitar la capa etérica con 250 cc de ácido clorhídrico 0,3-n, los extractos ácido clorhídricos reunidos se alcalinizan con amoniaco acuoso concentrado y, bajo buen enfriamiento, a continuación se extrae con cloruro metilénico y se seca la fase cloruro metilénica sobre carbonato potásico.

20. Después de secar se filtra la solución cloruro metilénica y se concentra por evaporación en vacío. La base en bruto, oleaginosa, obtenida como residuo, se disuelve, después de secar en 100 cc de dietiléter anhidro, se filtra e, introduciendo gas clorhídrico seco, se transforma en 23,8 g de hidrocloreto de 2-(metilamino-acetamido)-5-clorobenzofenona (88 % de la

25.

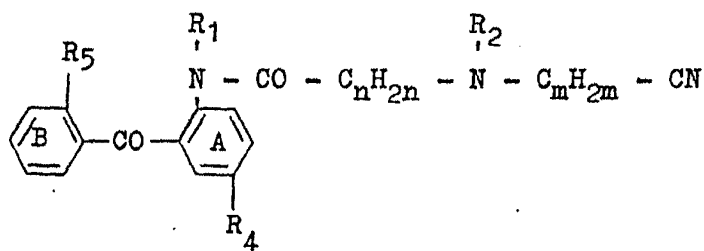


414707

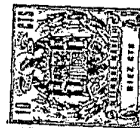
- 10 -

teoría), p.f. 199-201°.

En forma análoga a como se ha indicado en el ejemplo de arriba se sintetizaron los compuestos resumidos en la tabla a continuación:



R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	144-146°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH- CH ₃	Cl	H	145-147°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	131-133°
H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH- CH ₃	Cl	H	183-185°
H	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	175-177°



414707

- 11 = -

R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	184-186°
H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	146-148°
H	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH- CH ₃	Cl	H	136-138°
H	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	165-167°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	140-142°
CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	153-155°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	119-121°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH-CH ₂ - CH ₃	NO ₂	H	103-105°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	80- 82°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₂ -CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	121-123°
CH ₃	CH ₃ -CH-	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	126-128°



- 124-14707.

R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH- CH ₃	NO ₂	H	94 - 96°
H	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	NO ₂	H	200-202°
CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	149-152°
H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	179-181°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	CF ₃	H	113-115°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CF ₃	H	137-139°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH-CH ₂ - CH ₃	CF ₃	H	145-148°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH- CH ₃	CF ₃	H	129-131°
H	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	H	H	132-134°
H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CF ₃	H	143-146°



414707

- 13 -

R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	-CH ₂ -	C ₂ H ₅	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	NO ₂	H	106-109°
H	-CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	Cl	Cl	193-195°
CH ₃	-CH ₂ -	C ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	128-130°
CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	NO ₂	H	174-176°
CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	177-179°
CH ₃	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	139-141°
CH ₃	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	CF ₃	H	94- 96°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	Cl	H	109-111°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	NO ₂	H	102-104°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} -\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	126-128°



414707

- 14 -

R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	151-153°
CH ₃	CH ₃ -CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	97-100°
H	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	Cl	142-144°
H	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	Cl	128-130°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	143-145°
H	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	164-167°(Z)
H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	125-127°
H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -	H ₂ C-CH=CH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	128-130°
CH ₃	-CH ₂ -	n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	139-141°
CH ₃	-CH ₂ -	n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	127-129°
n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	Cl	H	177-179°
n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	163-165°(Z)



414707

- 15 -

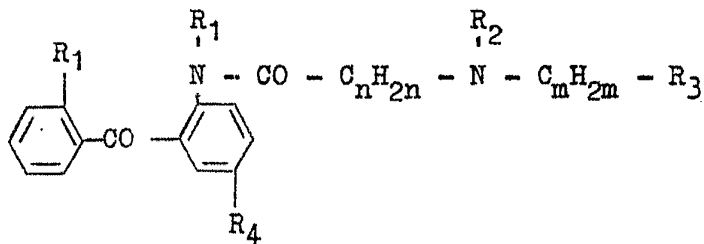
R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
CH ₃	-CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} \text{-CH-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	OCH ₃	H	136-138°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	OCH ₃	H	154-156°
CH ₃	-CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} \text{-HC-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{H}_3\text{C} \end{array}$	SCH ₃	H	134-136°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	SCH ₃	H	145-147°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃	H	152-154°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	$\begin{array}{c} \text{-CH-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	CH ₃	H	143-145°
CH ₃	-CH ₂ -	C ₂ H ₅	$\begin{array}{c} \text{-HC-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{H}_3\text{C} \end{array}$	NO ₂	H	123-125°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{-HC-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{H}_3\text{C} \end{array}$	Cl	Cl	152-155°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{-HC-CH}_2\text{-} \\ \\ \text{H}_3\text{C} \end{array}$	Cl	F	128-131°
n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -	n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	119-121°

414707



R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreto
H	-CH ₂ -	n-C ₄ H ₉	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	Cl	98-100°
CH ₃	-CH ₂ -	CH ₃	-CH ₂ -CH CH ₃	Cl	H	113-115°
CH ₃	-CH ₂ -	H	-CH-CH ₂ - CH ₃	NO ₂	H	129-131°

esí como



R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	R ₃	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreto
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-H ₂ C-CH ₂ -	Cl	H	111-113°(Z)
H	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-H ₂ C-CH ₂ -	Cl	H	105-107°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	CF ₃	H	137-139°

414707



- 17 -

R ₁	C _n H _{2n}	R ₂	R ₃	C _m H _{2m}	R ₄	R ₅	Punto de fusión del hidrocloreuro
H	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	Cl	129-131°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	NO ₂	H	127-129°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	Cl	H	136-138°
H	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	NO ₂	H	157-159°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	NO ₂	H	155-157°
CH ₂ -CH= CH ₂	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	116-118°(Z)
H	-CH ₂ -	CH ₃	COOH	-CH ₂ -CH ₂ -	Cl	H	154-157°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	OCH ₃	H	143-145°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	SCH ₃	H	143-145°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ -	CH ₃	H	108-111°(Z)
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	OCH ₃	H	84- 86°
CH ₃	-CH ₂ -	H	CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -	CH ₃	H	106-108°



- 18 - 414707

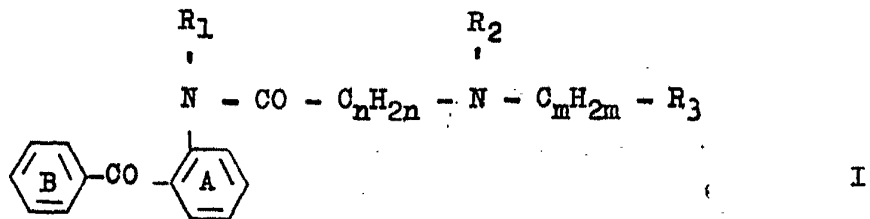
N O T A

Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica, debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente citadas son suscep-

5. tibles de modificaciones de detalle en cuanto no alteren su principio fundamental. También se hace constar que el invento corresponde a una solicitud de Patente presentada en Luxemburgo bajo el número 65.340 de 12 de mayo de 1972, acogiéndose por lo tanto a los beneficios que conceden los Convenios Internacionales en vigor, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita Patente de Invención por 20 años en España, sobre: PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE BENZOFENONA; caracterizándose por lo siguiente:
- 10.

1º.- Procedimiento para la obtención de derivados de

15. benzofenona, de fórmula general I



20.

y de sus sales de adición de ácido, en la que R₁ y R₂ significa hidrógeno o un resto de alquilo saturado o insaturado con 1 a 4 átomos de carbono, R₃ significa el grupo -CN, -CONH₂, -COOCH₃,
 25. -COOC₂H₅, -COOH ó COOMe, donde Me significa un catión de metal,

mte

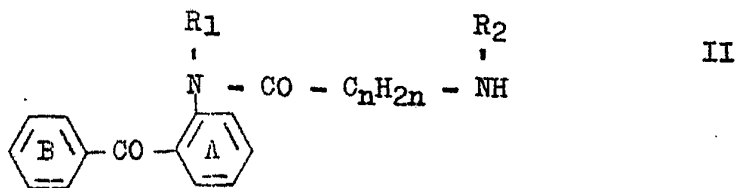
414707



- 19 -

n significa los números 1 ó 2 y m significa los números 2 ó 3 y los núcleos A y B pueden estar sustituidos, caracterizado porque un derivado de benzofenona de fórmula general II

5.



10.

se adosa a un compuesto que lleva un doble enlace alifático de fórmula general III



15.

2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracterizado porque los productos de partida se seleccionan de manera que en el producto final el núcleo A esté sustituido, preferentemente en la posición 5, por halógeno, nitro o trifluorometilo, metilo, metoxi ó metilmercapto, y el núcleo B preferentemente en la posición 2' por fluor o cloro y/o los restos

20.

R_1 significan hidrógeno o metilo y R_2 hidrógeno, metilo o butilo.

25.

3ª.- Procedimiento para la obtención de derivados de benzofenona, tal y como queda sustancialmente descrito en la presente Memoria.

ME

- 20 414707



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

Madrid, 12 MAYO 1973

CASELLA FARBERWERKE MAINKUR
AKTIENGESELLSCHAFT

L. GOMEZ ACEBO Y MUDER
En su Fianza: L. GOMEZ ACEBO Y MUDER

af