



416850

416850

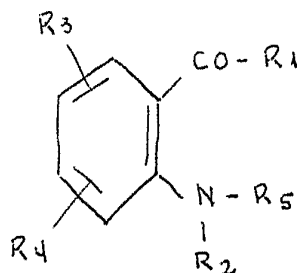
Int. Cl.<sup>a</sup>: C07E

MEMORIA DESCRIPTIVA

Correspondiente a una Patente de Invención por 20 años por: PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE - NUEVOS DERIVADOS DEL ACIDO ANTRANILICO, a fa-- vor de LABORATORIO FORTUNY, S.A., entidad espa ñola domiciliada en Palma de Mallorca, calle - Pablo Pifarrer, nº 43. Declara ser inventor -- del procedimiento DON FRANCISCO BONET PRATS.

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

La presente invención tiene por objeto un nue vo procedimiento de preparación de derivados del ácido antranílico, de formula general



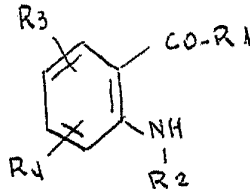
(I)

416850



5 donde R1 representa un grupo -NH2, -OH, -OR (Con R =  
 -CH3 o -C2H5) R2 equivale a un hidrogeno, metilo, pro-  
 pilo, butilo, isopropilo, isobutilo, cilopropilo o ci-  
 clohexilo. R3 y R4, que pueden ser iguales o diferen-  
 tes, representan un hidrogeno, un metilo o etilo, un  
 etoxi o metoxi, un halogeno o un trifluormetilo. R5 -  
 10 representa un radical nicotinoilo o isonicotinoilo.

El procedimiento consiste, en esencia, en -  
 hacer reaccionar el ácido antranílico o un derivado -  
 de este, de formula general



(II)

15 donde R1, R2, R3 y R4 tienen los mismos significados  
 asignados en la formula (I), con cloruro del ácido ni-  
 cotinico o isonicotinico, operando en el seno de un -  
 disolvente anhidro, no reactivo y miscible con el -  
 agua, del tipo de la acetona o el dioxano, en presen-  
 cia de una base organica terciaria, como la piridina,  
 20 la trietilamina o la dimetilnilina o de un carbonato  
 o bicarbonato alcalino. En algunos casos, puede usar-  
 se los hidroxidos sodico o potasico si bien la reac-  
 ción debe ser conducida con mayor precaución. En la -  
 mayoria de los casos se opera a la temperatura ambien-  
 25 te y agitando la masa de reacción durante un tiempo -  
 que varia entre 30 minutos y cuatro horas, seguidas -  
 de un periodo de reposo de 20-24 horas.

A titulo ilustrativo, para facilitar la me-  
 jor comprensión del procedimiento, se describe a con-  
 30 tinuación un ejemplo de preparaciones de cada uno de  
 los compuestos para los que es aplicable dicho proce-  
 dimiento.

EJEMPLO - Isonicotinoil-antranilato de meti-  
 lo. - Una mezcla de 12,5 gr. de ácido isonicotinico y



35 40 c.c. de cloruro de tionilo se calienta a reflujo du-  
rante 1 hora y a continuación se elimina el exceso de  
cloruro de tionilo por destilación. Se deja enfriar y  
el residuo solido se trata con tolueno, se separa por  
filtración, se lava con más tolueno y se suspende en -  
40 125 c.c. de acetona anhidra: esta suspensión se añade  
con precaución y agitando fuertemente sobre una solu-  
ción de 13 c.c. de antranilato de metilo en 125 c.c. -  
de acetona a la que se ha añadido 28 gr. de carbonato  
potasico anhidro. Se agita durante cuatro horas y se -  
45 deja en reposo hasta el dia siguiente. A continuación,  
se separa por filtración el precipitado, se lava con -  
acetona, se agita con 500 c.c. de agua helada durante  
10 minutos para eliminar el cloruro sodico, se separa  
nuevamente por filtración, se lava con acetona y se re  
50 cristaliza en etanol. Se obtienen 15 gr. de producto -  
que funde a 118-120°C.

Queda sobreentendido que la protección que -  
se recaba para la presente invención, no queda limita-  
da al ejemplo de ejecución practica descrito más arri-  
55 ba, sino que se extiende a todas aquellas formas esen-  
cialmente equivalentes de realización del procedimien-  
to, siempre y cuando queden comprendidas dentro de la  
siguiente

= N O T A =

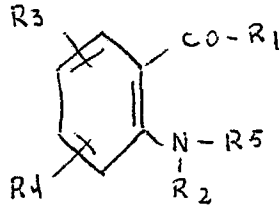
60 La Patente de Invención que se solicita, re-  
caerá sobre las particulares características de las si  
guientes

= R E I V I N D I C A C I O N E S =

1ª - Procedimiento de preparación de deriva-



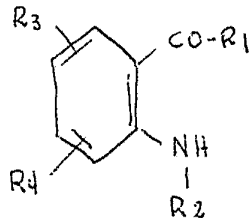
65 dos del ácido antranílico, de fórmula general



(I)

70 donde R<sub>1</sub> representa un grupo -NH<sub>2</sub>, OH, OR (Con R = CH<sub>3</sub> o C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), R<sub>2</sub> equivale a un hidrógeno, metilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, ciclopropilo o ciclohexilo. R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, que pueden ser iguales o diferentes, representan un hidrógeno, un metilo o etilo, un grupo metoxi o etoxi, un átomo de halógeno o un grupo trifluorometilo. R<sub>5</sub> representa un radical nicotinoilo o isonicotinoilo.

75 2<sup>a</sup> - Procedimiento de preparación de derivados del ácido antranílico, de acuerdo con la reivindicación precedente, caracterizado por el hecho de que - un derivado del ácido antranílico de fórmula general



(II)

se hace reaccionar con el cloruro del ácido nicotínico o isonicotínico.

80 3<sup>a</sup> - Procedimiento de preparación de derivados del ácido antranílico, de acuerdo con las reivindicaciones precedentes, caracterizado por el hecho de -- que la reacción se realiza a la temperatura ambiente.

85 4<sup>a</sup> - Procedimiento de preparación de derivados del ácido antranílico, de acuerdo con las reivindicaciones precedentes, caracterizado por el hecho de -- que la reacción se realiza en el seno de un disolvente anhidro miscible con el agua, preferentemente la acetona o el dióxano.



90                    5ª - Procedimiento de preparación de deriva-  
dos del ácido antranílico, de acuerdo con las reivindi-  
caciones precedentes, caracterizado por el hecho de --  
que la reacción tiene lugar en presencia de una base -  
orgánica terciaria o de un hidróxido, carbonato o bi--  
95                    carbonato alcalino.

6ª - PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE DERIVA-  
DOS DEL ACIDO ANTRANILICO.

100                    Todo ello tal y como se describe y reivindica  
ca en la presente Memoria Descriptiva, que consta de -  
cinco hojas mecanografiadas por una sola de sus caras  
y debidamente numeradas.

Madrid, 12 de Julio de 1.973

VICENTE OCHOA  
F.P.

A handwritten mark consisting of a single, curved stroke, possibly a signature or initials.

A large, stylized handwritten signature that overlaps the typed name "VICENTE OCHOA".