

416851



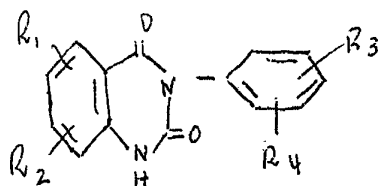
Int. Cl.²: C07D

MEMORIA DESCRIPTIVA

Correspondiente a una Patente de Invención por 20 años, para todo el territorio español, por: PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE QUINAZOLINODI⁰NAS, a favor de LABORATORIO FARTUNY, S.A., entidad española, 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 nuevo procedimiento de preparación de 2,4-quinazolinosiso--nas, de formula general.

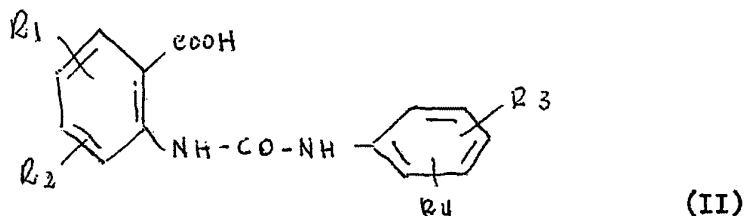


(I)



5 donde R1, R2, R3 y R4, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno, un alcohol de 1 a 4 carbonos, un grupo metoxi o etoxi, un halógeno o un trifluor-metilo.

10 El procedimiento consiste, en esencia, en tratar con un agente ciclante del tipo del tricloruro de fosforo, el pentacloruro de fosforo o el cloruro de tionilo, un compuesto de fórmula general.



en el que R1, R2, R3 y R4 tienen los significados asignados en la fórmula (I).

15 La reacción se realiza en el seno de un disolvente anhidro, preferentemente el dioxano, operando a la temperatura de reflujo y agitando durante un tiempo que oscila entre una y tres horas.

20 El compuesto de fórmula (II), puede obtenerse haciendo reaccionar el correspondiente derivado del ácido antranílico con el isocianato adecuado, operando en las condiciones habituales para este tipo de reacciones.

25 Con objeto de facilitar la mejor comprensión del método, se describe a continuación un ejemplo de preparación de uno de los compuestos para los que es aplicable dicho procedimiento.

EJEMPLO a) 1-fenil-3-(2-carboxifenil)-urea.-
30 Sobre una solución de 39 gr. de ácido antranílico en 500 c.c. de tolueno anhidro, se añaden 33 c.c. de isocianato de fenilo, agitando fuertemente y calentando en baño de aceite a 160°C. durante dos horas. Después de de-



12

jar enfriar, se separa por filtración la masa solida -
formada y se recriataliza en metanol. Se obtienen 65 -
gr. de producto que funde a 200-205°C.

35 b) 3-fenil-1,4-dioxo-quinazolina.- 50 gr. --
del producto obtenido de la forma descrita en el apar-
tado a), se disuelven en 300 c.c. de dioxano anhidro y
se añaden 8,4 gr. de pentacloruro de fosforo. Con agi-
tación, se calienta la mezcla al baño de aceite mante-
nido a 120°C durante tres horas. Se deja enfriar, se -
40 separa el producto solido por filtración y después de
lavar con dioxano y eter de petroleo, se obtienen 40 -
gr. de producto que funde a 280-283°C.

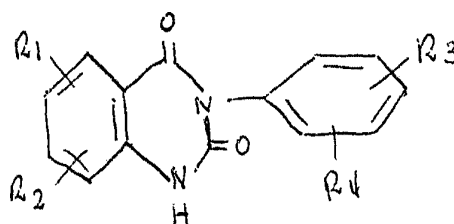
45 Queda sobreentendido que la protección que -
se recaba para la presente invención, no queda limita-
da al ejemplo de ejecución practica descrito más arri-
ba, sino que se extiende a todas aquellas formas esen-
cialmente equivalentes de realización del procedimien-
to, siempre y cuando queden comprendidas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

50 = N O T A =

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

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

55 1ª - Procedimiento de preparación de quinazo-
linodionas, de formula general

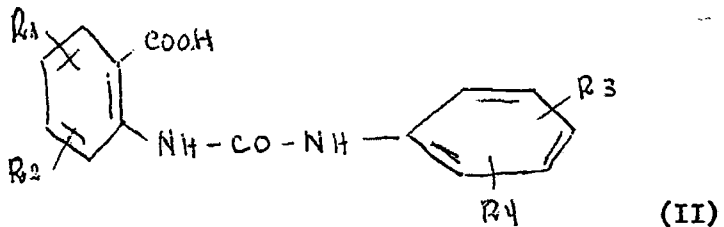


(I)



60 donde R1, R2, R3 y R4, pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno, un alcohol de 1 a 4 carbonos, un grupo metoxi o etoxi, un halógeno o un trifluorometilo.

2a - Procedimiento de preparación de quinazolinodionas, de acuerdo con la reivindicación precedente, caracterizado por el hecho de que un compuesto de fórmula general



65 en el que R1, R2, R3 y R4 tienen los significados asignados en la fórmula (I), se trata con un agente ciclan- te del tipo del tricloruro o el pentacloruro de fosfo- ro o el cloruro de tionilo.

70 3a - Procedimiento de preparación de quinazo- linodionas, de acuerdo con las reivindicaciones prece- dentes, caracterizado por el hecho de que la reacción tiene lugar en el seno de un disolvente anhidro, de -- preferencia el dioxano.

75 4a - Procedimiento de preparación de quinazo- linodionas, de acuerdo con las reivindicaciones prece- dentes, caracterizado por el hecho de que la mezcla de reacción se calienta a la temperatura de reflujo del - disolvente.

80 5a - PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE QUINAZO- LINODIONAS.

A



Todo ello tal y como se describe y reivindicca 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
P.B.