



ESPAÑA

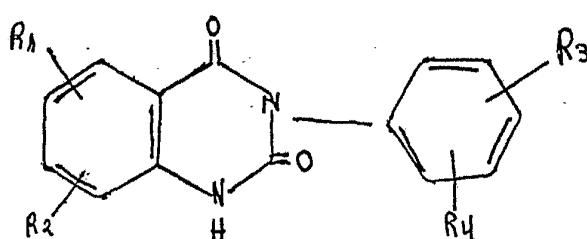
19 ES	11	NUMERO	416852	10 A1
	21			
	22	FECHA DE PRESENTACION		

PATENTE DE INVENCION

30 PRIORIDADES:		
31 NUMERO	32 FECHA	33 PAIS
47 FECHA DE PUBLICIDAD	51 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D//A61K	62 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA
64 TITULO DE LA INVENCION "PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE QUINAZOLINODIONAS" OPROCEDIDO 25 OCT. 1976		
71 SOLICITANTE (S) LABORATORIO VORTUNY, S.A.		
DOMICILIO DEL SOLICITANTE PALMA DE MALLORCA.- pablo piferrier,		
72 INVENTOR (ES) D. FRANCISCO BONET PRATS		
73 TITULAR (ES) EL SOLICITANTE		
74 REPRESENTANTE VICENTE OCHOA SOUTO		

MEMORIA DESCRIPTIVA

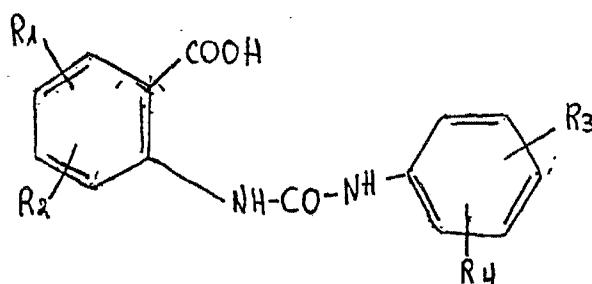
La presente invención tiene por objeto un nuevo -
procedimiento de preparación de 2,4-quinazolinodionas, de
formula general.



(I)

5 dónde R1, R2, R3 y R4, que pueden ser iguales o diferentes,
representan un átomo de hidrógeno, un alcoholo de 1 a 4 -
carbonos, un grupo metoxi o etoxi, un halogeno o un tri-
fluor-metilo.

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



(II)

en el que R1, R2, R3 y R4 tienen los significados asigna-
dos en la formula (I).

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

El compuesto de fórmula (II), puede obtenerse ha-
ciendo reaccionar el correspondiente derivado del ácido -

20 antranílico con el isocianato adecuado, operando en las condiciones habituales para este tipo de reacciones.

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 -
25 dicho procedimiento.

EJEMPLO a) 1-fenil-3-(2-carboxifenil)-urea.- 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 -
30 aceite a 160°C. durante dos horas. Después de dejar enfriar, se separa por filtración la masa sólida formada y se recristaliza en metanol. Se obtienen 65 gr. de producto que funde a 200-205°C.

b) 3-fenil-1,4-dioxo-quinazolina.- 50 gr. del --
35 producto obtenido de la forma descrita en el apartado a), se disuelven en 300 c.c. de dioxano anhidro y se añaden - 8,4 gr. de pentacloruro de fósforo. Con agitación, se calienta la mezcla al baño de aceite mantenido a 120°C. durante tres horas. Se deja enfriar, se separa el producto
40 sólido por filtración y después de lavar con dioxano y -- éter de petróleo, se obtienen 40 gr. de producto que funde a 280-283°C.

Queda sobreentendido que la protección que se re-
caba para la presente invención, no queda limitada al --
45 ejemplo de ejecución práctica descrito más arriba, sino - que se extiende a todas aquellas formas esencialmente -- equivalentes de realización del procedimiento, siempre y cuando queden comprendidas dentro de la siguiente

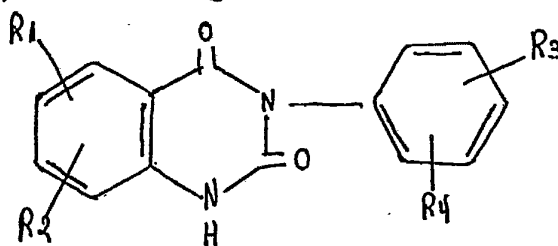
= N O T A =

La Patente de Invención que se solicita, recaerá
50 sobre las particulares características de las siguientes

...oooOooo...

= REIVINDICACIONES =

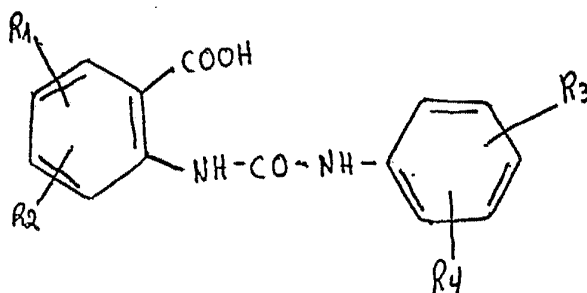
1ª.- Procedimiento de preparación de quinazolinodionas, de fórmula general



(I)

dónde R1, R2, R3 y R4, pueden ser iguales ó diferentes --
representan un átomo de hidrógeno, un alcoholo de 1 a 4 -
55 carbonos, un grupo metoxi o etoxi, un halogeno o un tri-
fluormetilo.

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



(II)

en el que R1, R2, R3 y R4 tienen los significados asigna-
dos en la formula (I), se trata con un agente ciclante --
del tipo del tricloruro o el pentacloruro de fósforo o el
cloruro de tionilo.

65 3ª.- Procedimiento de preparación de quinazolinodionas, de acuerdo con las reivindicaciones precedentes,

caracterizado por el hecho de que la reacción tiene lugar en el seno de un disolvente anhidro, de preferencia - el dioxano.

70

4º.- Procedimiento de preparación de quinazolinodionas, de acuerdo con las reivindicaciones precedentes, caracterizado por el hecho de que la mezcla de reacción - se calienta a la temperatura de reflujo del disolvente.

75

5º.- PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE QUINAZOLINODIONAS.

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

Madrid, 12 de Julio de 1.973.

VICENTE OCHOA
P.P.

