

432544

Int. Cl.: C07D 209/24 (1961) K 31/405

## MEMORIA DESCRIPTIVA

correspondiente a la solicitud de concesión de un\_a

### PATENTE DE INVENCION

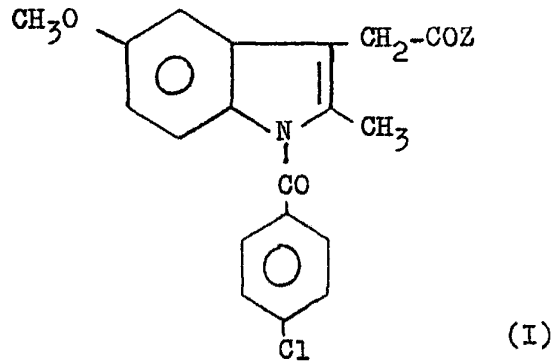
SOLICITANTE: ALTER, S.A.

RESIDENCIA: Mateo Inurria nº 30 - MADRID-16

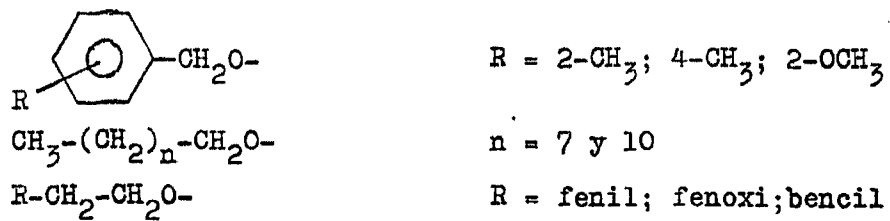
ENUNCIADO: UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE  
CIERTOS ESTERES ALCOHOLICOS DEL ACIDO  
1-(P-CLOROBENZOL)-5-METOXI-2-METIL-  
INDOL-3-ACETICO.

Prioridad: Patente ..... n.º ..... del .....

1 La presente invención se refiere a un procedimiento de preparación de ciertos ésteres alcohólicos del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético, de fórmula general (I),



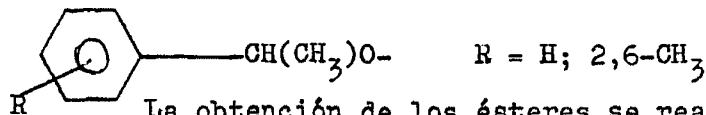
donde el sustituyente Z representa un resto alcohólico como:



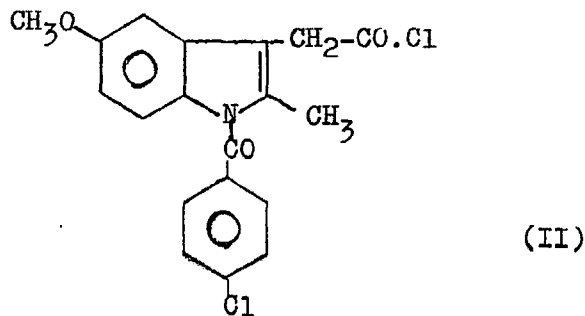
tetrahidrofurfurool

furfurool

20 piperanol



La obtención de los ésteres se realiza haciendo reaccionar el cloruro del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético de fórmula (II),



1 con los alcoholes correspondientes, lo que constituye la  
esencialidad de esta invención.

5 Esta reacción se puede llevar a cabo ventajosamente  
en el seno de un disolvente inerte, tal como diclorometano,  
y en presencia de una base como la trietilamina,  
operando a temperatura de ebullición del disolvente. Bien  
entendido que ni el disolvente, ni la base, tienen otro  
carácter distinto del meramente ilustrativo.

10 Los productos que puedan obtenerse utilizando el  
procedimiento a que hace mención esta invención, pueden re-  
sultar potencialmente útiles como agentes antiinflamatorios  
analgésicos y antipiréticos. Así los derivados citados co-  
mo ejemplos en esta memoria, presentan las actividades bio-  
lógicas antes mencionadas.

15 Los ejemplos siguientes, que no deben considerarse  
limitativos de la invención, ilustran los principales  
aspectos antes mencionados. La estructura de los compues-  
tos obtenidos, han sido caracterizados por su análisis ele-  
mental de C,H,N y Cl; espectroscopía IR, UV y RMN.

20

#### EJEMPLOS

Método general de obtención de los ésteres alcohólicos del  
ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

25

A una solución de 0,02 moles del cloruro del áci-  
do 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético en 50  
ml de cloruro de metileno, se le adiciona 0,02 moles del al-  
cohol correspondiente y 3 ml de trietilamina. La mezcla  
se hierve a reflujo durante 2 horas. Luego de enfriar la  
solución, se lava tres veces con agua y posteriormente se  
seca con sulfato de sodio anhidro. El residuo que queda  
30 luego de evaporar el disolvente se cristaliza de metanol.

1 Los productos finales se purifican por recristalización  
de metanol. Aplicando este método general de obtención de  
ésteres, se han preparado los siguientes compuestos a ma-  
nera de ejemplo:

5 1) Ester 2-metilbencílico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-  
metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 133-134°C.

2) Ester 4-metilbencílico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-  
metoxi-2-metilindol-3-acético.

10 Producto sólido de p.f. 115-116°C.

3) Ester 2-metoxibencílico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-  
metoxi-2-metilindol-3-acético.

Producto sólido de p.f. 104-105°C.

15 4) Ester de nonanol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-  
2-metilindol-3-acético.

Producto oleoso, purificado por lavados con agua  
y solución diluida de amoníaco.

5) Ester laúrico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-  
metilindol-3-acético.

20 Producto oleoso, purificado por lavados con agua  
y solución diluida de amoníaco.

6) Ester 2-feniletanólico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-  
metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 112-113°C.

25 7) Ester 2-fenoxietanólico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-  
5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 104-105°C.

8) Ester 3-fenil-1-propanólico del ácido 1-(p-clorobenzoil)-  
5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

30 Sólido de p.f. 63-65°C.

1 9) Ester de tetrahidrofurfurol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 114-115°C.

5 10) Ester de furfurol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 99-100°C.

11) Ester de piperanol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

Sólido de p.f. 105-106°C.

10 12) Ester de fenilmetilcarbinol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

Producto sólido de p.f. 91-92°C.

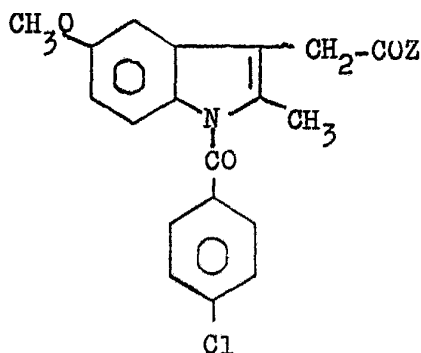
13) Ester de 2,6-dimetilfenilmetilcarbinol del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético.

15 Producto sólido de p.f. 114-116°C.

En resumen, la patente de invención que se solicita recaerá sobre las siguientes:

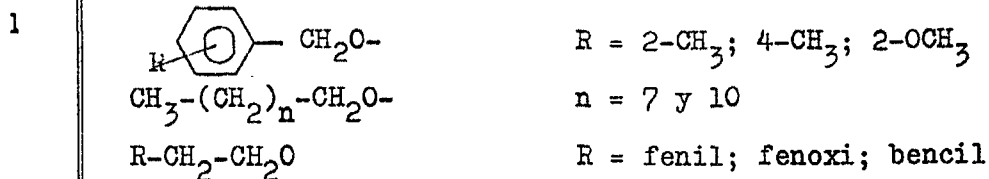
REIVINDICACIONES

20 1. Un procedimiento de preparación de ciertos ésteres alcohólicos del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético de fórmula general (I)



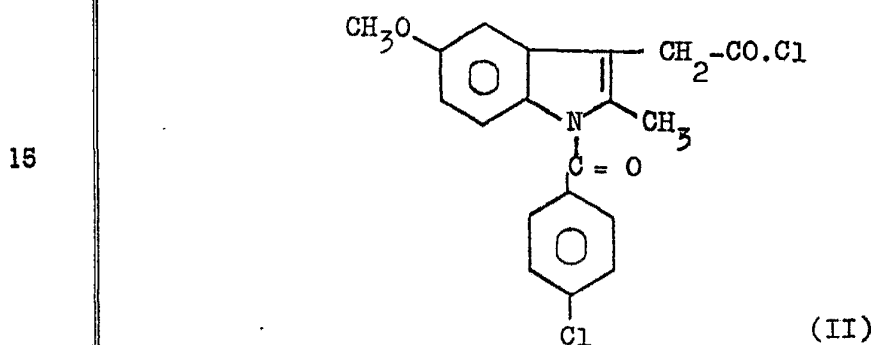
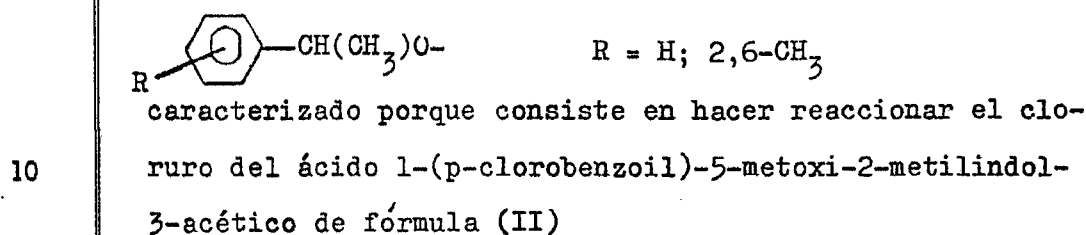
25 en la que el sustituyente Z representa un resto alcohólico como:

30



5

tetrahidrofurfurol  
furfurol  
piperanol



20 con los derivados alcohólicos correspondientes al resto Z descrito anteriormente.

25 2. Un procedimiento de preparación de ciertos ésteres alcohólicos del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético, según la reivindicación 1ª, caracterizado porque la reacción entre el cloruro del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético de fórmula (II), con los derivados alcohólicos correspondientes al resto Z mencionado en la reivindicación 1ª, se lleva a cabo en el seno de un disolvente inerte y en presencia de una base.

30 3. Un procedimiento de preparación de ciertos ésteres

1

terres alcohólicas del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético, según las reivindicaciones 1 y 2, caracterizado porque el disolvente es el diclorometano.

5

4. Un procedimiento de preparación de ciertos ésteres alcohólicos del ácido 1-(p-clorobenzoil)-5-metoxi-2-metilindol-3-acético, según las reivindicaciones 1, 2 y 3, caracterizado porque la base es la trietilamina.

10

5. Se reivindica por último como objeto sobre el que ha de recaer la patente de invención que se solicita:  
UN PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE CIERTOS ESTERES ALCOHOLICOS DEL ACIDO 1-(P-CLOROBENZOIL)-5-METOXI-2-METILINDOL-3-ACETICO.

15

Todo conforme queda descrito y reivindicado en la presente memoria descriptiva que consta de siete páginas mecanografiadas.

20

Madrid, 3 diciembre 1974

BERNARDO UNGRIA

P.P.



25

30