



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patentihakemus-Patentansökan 863084

(51) Kv.lk.⁴/Int.Cl.⁴ C 07 C 97/10, 103/38
// C 07 D 239/80

(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 28.07.86

(23) Alkupäivä-Löpdag

(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 30.01.87

(86) Kv. hakemus-Int. ansökan

(30) Etuoikeus-Prioritet 29.07.85 US 759973

(71) Hakija/Sökande: Ortho Pharmaceutical Corporation, U.S. Route 202, Raritan, N.J., USA

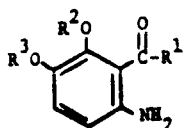
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Conley, Richard A. 2. Barton, Donald L.

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

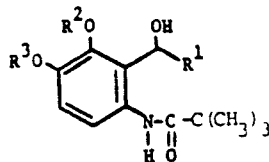
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä 2-asyyli -3,4-dialkoksianiliinien valmistamiseksi. Förfarande för framställning av 2-asyyl-3,4-dialkoksianiliner.

(57) Tiivistelmä

Esitetään menetelmä kaavan I mukaisten 2-asyyli-3,4-dialkoksianiliinien valmistamiseksi. Tässä menetelmässä asyloidaan 3,4-dialkoksianiliini pivaloyylihalogenidilla tai -anhydridillä, saatu anilidi saatetaan reagoimaan kaavan R-Li mukaisen orgaanisen litiumyhdisteen kanssa ja saatu tuote kaavan R¹-CHO mukaisen aldehydin kanssa, muodostunut alkoholi, jolla on kaava II, hapetetaan vastaavaksi asyylilyhdisteeksi ja hydrolysoidaan hapolla. Keksintö koskee myös kaavan II mukaisia välituotteita. Yllä mainituissa kaavoissa R¹, R² ja R³ tarkoittavat alempaa alkyyliä tai R² ja R³ yhdessä muodostavat metyleenidioksiryhmän ja R on n-butyyl, sek-butyyl tai tert-butyyl. Nämä 2-asyyli-3,4-dialkoksianiliinit ovat käyttökelpoisia välituotteina kardiotonisesti aktiivisten 5,6-dialkoksi-4-alkyyli-2(1H)-kinatsolinonien valmistuksessa.



(I)



(II)

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av 2-acyl-3,4-dialkoksianiliner med formeln I. I detta förfarande acyleras 3,4-dialkoksianilin med pivaloylhalogenid eller -anhydrid, den erhållna aniliden omsätts med en organisk litiumförening med formeln R-Li och den erhållna reageras med en aldehyd med formeln R¹-CHO, varefter den bildade alkoholen med formeln II oxideras till motsvarande acylförening och hydrolyseras med en syra. Uppfinningen avser även mellanprodukter med formeln II. R¹, R² och R³ i de ovannämnda formlerna betecknar lägre alkyl eller R² och R³ bildar tillsammans metylendioxi, och R är n-butyl, sek-butyl eller tert-butyl. Dessa 2-acyl-3,4-dialkoksianiliner är användbara som mellanprodukter vid framställningen av kardiotoniskt aktiva 5,6-dialkoxi-4-alkyl-2(1H)-kinazolinoner.