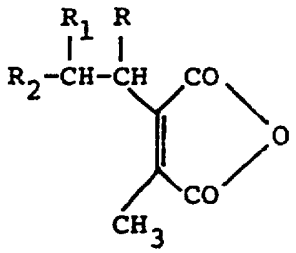
C 07 D 307 Ans.nr.: 4757/82
Indleveret: 27 okt 1982
Løbedag: 27 okt 1982
Alm. tilgængelig: 29 apr 1983
Prioritet: 28 okt 1981 CH 6880/81
*CIBA–GEIGY AG; Basel, CH.
Opfinder: Werner *Breitenstein; CH, Marcus *Baumann; CH, Hans *Bosshard; CH.
Fuldmægtig: Dansk Patent Kontor ApS

Asymmetrisk substituerede maleinsyrederivater samt fremgangsmåde til fremstilling deraf

SAMMENDRAG

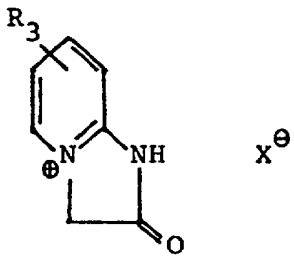
4757-82

Asymmetrisk substituerede maleinsyreanhydrider med formlen



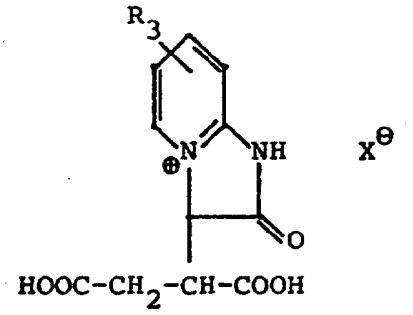
(I)

hvori R er H, alkyl, usubstitueret eller med halogen, methoxy eller alkyl substitueret phenyl, R_1 er H, alkyl, cycloalkyl, usubstitueret eller med halogen, methoxy eller alkyl substitueret phenyl, eller R og R_1 sammen betyder $-(CH_2)_3-$ eller $-(CH_2)_4-$, og R_2 er -CO-alkyl, -COphenyl, som kan være substitueret med alkyl, -CN, -COO-alkyl, -COO-allyl eller -COOH, eller hvori R_1 er H, og R og R_2 sammen betyder $-(CH_2)_3-CO-$, idet carbonylgruppen i den således dannede ring er i m-stilling til -CH-gruppen, fremstilles ved, at man, når R er H, til en forbindelse med formlen



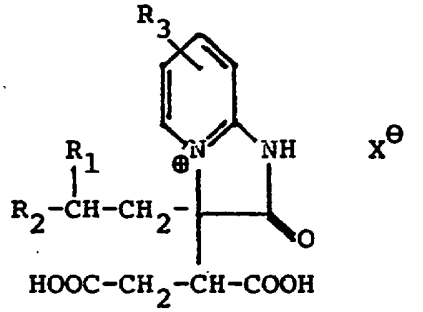
(II)

hvori $X^{\ominus}$ er en anion af en organisk eller uorganisk syre, først i nærværelse af en base sætter fumarsyre, maleinsyre eller maleinsyreanhydrid og derefter i nærværelse af en stærk syre omsætter til en forbindelse med formlen



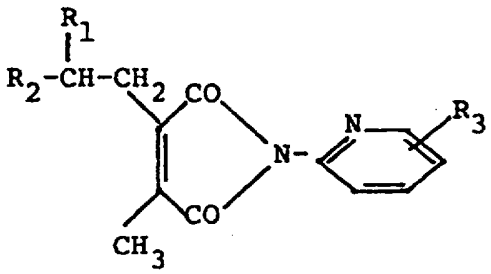
(III)

som omsættes med en forbindelse med formlen $CH_2=C(R_1)(R_2)$ til en forbindelse med formlen



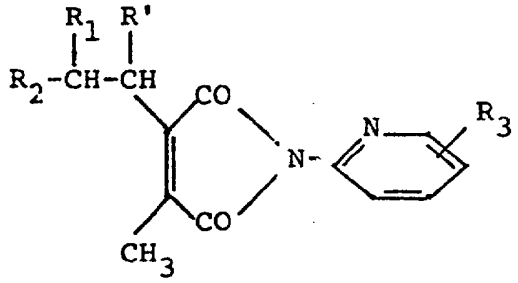
(V)

der opvarmes til 80-160°C til dannelse af en blanding af forbindelsen I, hvori R er H, og en forbindelse med formlen



(VIa)

som hydrolyseres med vandig syre til en forbindelse I, hvori R er H, eller, når R ikke er H, til en forbindelse med formlen II først i nærværelse af en base sætter en forbindelse med formlen R'-CH=C(R_1)(R_2) og derefter ved 80-160°C omsætter med fumarsyre, maleinsyre eller maleinsyreanhydrid til dannelse af en blanding af en forbindelse I, hvori R ikke er H, og en forbindelse med formlen



(VIb)

som hydrolyseres med vandig syre til en forbindelse I, hvori R ikke er H.

Fremgangsmåden er enkel og muliggør fremstilling af asymmetrisk substituerede maleinsyreanhydrider med hydrolyseføls omme substituenter i 3- eller 4-stillingen.