



(12) Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 17 Absatz 1 Patentgesetz

(19) DD (11) 239 201 A1

4(51) C 07 D 239/91

AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

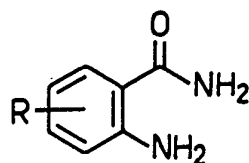
(21) WP C 07 D / 278 346 3 (22) 08.07.85 (44) 17.09.86

(71) Akademie der Wissenschaften der DDR, 1080 Berlin, Otto-Nuschke-Straße 22/23, DD

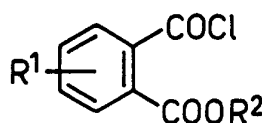
(72) Süße, Manfred, Dr. Dipl.-Päd.; Adler, Frank, Dipl.-Chem.; Johne, Siegfried, Prof. Dr. sc. Dipl.-Chem., DD

(54) Verfahren zur Herstellung von 2-(4-Oxo-chinazolin-2-yl)-benzoesäureestern

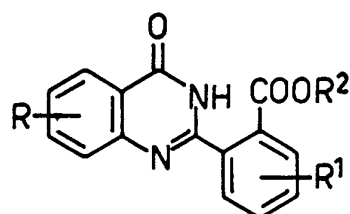
(57) Ziel der Erfindung ist es, neue, biologisch aktive Chinazolinon-benzoesäureester der Praxis als Wirkstoffe zur Verfügung zu stellen. Erfindungsgemäß wird ein 2-Amino-benzamid der allgemeinen Formel I in Lösung oder Suspension in einem organischen Lösungsmittel unter Zusatz einer Hilfsbase mit einem Phthaloylchlorid der allgemeinen Formel II zur entsprechenden Verbindung der allgemeinen Formel III umgesetzt. Unter den Verbindungen der allgemeinen Formel III befinden sich fungizid wirksame Substanzen. Formeln I bis III



I



II



III

Erfindungsanspruch:

1. Verfahren zur Herstellung von 2-(4-Oxo-chinazolin-2-yl)-benzoesäureester der allgemeinen Formel III, **dadurch gekennzeichnet**, daß man ein 2-Amino-benzamid der allgemeinen Formel I in Lösung oder Suspension in einem organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Hilfsbase mit einem Phthaloylchlorid der allgemeinen Formel II umsetzt, wobei in den allgemeinen Formeln R und R¹ (gleich oder verschieden) für H, Alkyl, Alkoxy, CN, NO₂, COAlkyl, COOAlkyl, Halogen und R² für Alkyl (C₁-C₄) stehen.
2. Verfahren nach Punkt 1, **dadurch gekennzeichnet**, daß als Hilfsbasen Alkalikarbonate oder tertiäre Amine eingesetzt werden.
3. Verfahren nach Punkt 1 und 2, **dadurch gekennzeichnet**, daß beim Einsatz einer flüssigen Hilfsbase diese gleichzeitig als Lösungsmittel verwendet wird.
4. Verfahren nach einem der Punkte 1 bis 3, **dadurch gekennzeichnet**, daß die Reaktion in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt wird.

Hierzu 1 Seite Formeln

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung ist für die Land-, Garten- und Forstwirtschaft von Interesse, wo erfindungsgemäß hergestellte Verbindungen, z. B. als Fungizide, einsetzbar sind.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Bekannt ist bisher die Umsetzung von Anthranilamid mit Benzoylchlorid zu o-Benzamidobenzanilid, das nur in siedendem Benzoylchlorid zum 3,4-Dihydro-4-oxo-2,3-diphenylchinazolin cyclisiert werden konnte. Die Cyclisierung mit anderen Säurechloriden führte nicht zum Erfolg (W. L. F. Armarego: „The Chemistry of Heterocyclic Compounds“, 24. Band „Fused Pyrimidines, I. Quinazolines“, New York, London, Sydney 1967). Chinazolinon-benzoesäureester der allgemeinen Formel III sind bisher nicht bekannt.

Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist es, neue, biologisch aktive Chinazolinon-benzoesäureester der Praxis als Wirkstoffe zur Verfügung zu stellen.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Die Aufgabe der Erfindung besteht darin, ein Verfahren zur Herstellung von 2-(4-Oxo-chinazolin-2-yl)-benzoesäureestern der allgemeinen Formel III zu entwickeln.

Erfindungsgemäß wird ein 2-Amino-benzamid der allgemeinen Formel I in Lösung oder Suspension in einem organischen Lösungsmittel unter Zusatz einer Hilfsbase mit einem Phthaloylchlorid der allgemeinen Formel II zur entsprechenden Verbindung der allgemeinen Formel III umgesetzt. In den allgemeinen Formeln I, II und III stehen R und R¹ (gleich oder verschieden) für H, Alkyl, Alkoxy, CN, NO₂, COAlkyl, COOAlkyl, Halogen und R² für Alkyl (C₁-C₄).

Als Hilfsbase eignen sich Alkalikarbonate und tertiäre Amine, darunter auch heterocyclische Stickstoffbasen. Setzt man ein flüssiges tertiäres Amin als Hilfsbase ein, kann diese gleichzeitig auch als Lösungsmittel verwendet werden. Es ist vorteilhaft, die Reaktion zu katalysieren. Ein geeigneter Katalysator ist z. B. 4-Dimethylaminopyridin. Als zweckmäßig hat sich dabei die Verwendung von Pyridin als Hilfsbasen und Lösungsmittel erwiesen. Die Umsetzung wird im allgemeinen bei Raumtemperatur durchgeführt, es kann aber auch leicht erwärmt werden.

Das erfindungsgemäße Verfahren ermöglicht erstmalig die Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel III.

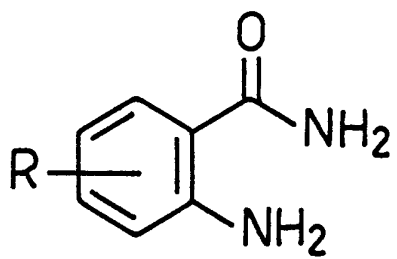
Die Verbindungen der allgemeinen Formel III sind biologisch aktiv. Unter ihnen befinden sich solche, die eine fungizide Wirkung zeigen.

Die Erfindung wird nachstehend durch Ausführungsbeispiele erläutert.

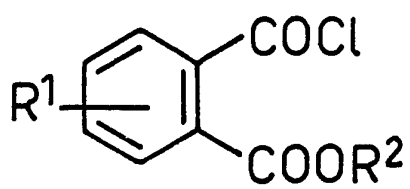
Ausführungsbeispiele

Beispiel 1

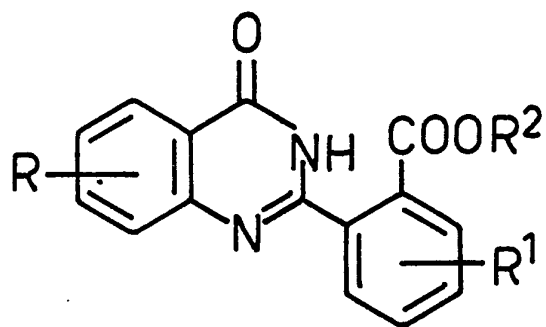
Zu einer Lösung von 1,36 g 2-Amino-benzamid (I: R = H) und 20 mg 4-Dimethylaminopyridin in 40 ml Pyridin werden unter Rühren 3,97 g Phthalsäuremethylesterchlorid (II: R¹ = H, R² = CH₃) langsam zugegeben. Nach einer Stunde wird das Pyridin im Vakuum abdestilliert, der Rückstand mit Wasser gewaschen und aus Methanol umkristallisiert. Schmp.: 156–158°C, Ausbeute: 2 g (71% d. Th.) 2-(4-Oxo-chinazolin-2-yl)-benzoesäuremethylester (III: R, R¹ = H; R² = CH₃).



I



II



III