



REPÚBLICA FEDERATIVA DO BRASIL

Ministério do Desenvolvimento, Indústria e Comércio Exterior
Instituto Nacional da Propriedade Industrial



CARTA PATENTE N.º PI 0411717-4

Patente de Invenção

O INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL concede a presente PATENTE, que outorga ao seu titular a propriedade da invenção caracterizada neste título, em todo o território nacional, garantindo os direitos dela decorrentes, previstos na legislação em vigor.

(21) Número do Depósito : PI 0411717-4

(22) Data do Depósito : 11/06/2004

(43) Data da Publicação do Pedido : 06/01/2005

(51) Classificação Internacional : C07C 303/40; C07C 311/51

(30) Prioridade Unionista : 25/06/2003 EP 03 014232.7

(54) Título : PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE ACILSULFAMOILBENZAMIDAS

(73) Titular : Bayer CropScience AG, Sociedade Alemã. Endereço: Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, Alemanha (DE).

(72) Inventor : Mark James Ford. Endereço: Geirfeld 19, D-65815 Bad Soden, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Günter Schlegel, Pesquisador(a). Endereço: Feldebergstrasse 18, 65835, Liederbach, Alemanha.; SERGIY PAZENOK. Endereço: Am Flachsland 56, 65779 Kelkheim, Alemanha. Cidadania: Ucrainiana.

Prazo de Validade : 20 (vinte) anos contados a partir de 11/06/2004, observadas as condições legais.

Expedida em : 21 de Janeiro de 2014.

Assinado digitalmente por
Liane Elizabeth Caldeira Lage
Diretora de Patentes Substituta



Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE ACILSULFAMOILBENZAMIDAS"**.

A presente invenção refere-se ao campo técnico de processos químicos para a preparação de compostos, particularmente um processo para a preparação de uma faixa ampla de acilsulfamoilbenzamidas, cujos compostos são úteis, por exemplo, como agentes de segurança para pesti-
5 cidas.

O uso de agentes de segurança é uma ferramenta crescentemente valiosa para estender a utilidade prática de muitos tipos de pesticidas, em particular, herbicidas, em plantas de cultivo de plantas úteis tais como
10 milho, arroz ou cereais, particularmente, na aplicação pós-emergência.

A Publicação de Patente Número WO 99/16744 descreve derivados da acilsulfamoilbenzamida e seu uso como agentes de segurança para o controle de ervas daninhas pelos herbicidas. As misturas de herbicidas seguras possuem propriedades agrônomas muito desejáveis e podem ter
15 potencialmente utilidade comercial.

São descritos vários processos para a preparação destes compostos na publicação acima, entretanto, estes métodos nem sempre são eficientes e requerem geralmente muitas etapas de reação partindo de materiais de partida facilmente disponíveis. Conseqüentemente, é valioso o desenvolvimento de um novo processo que não sofre destas desvantagens e pode, portanto, ser útil para operações em escala industrial.
20

Dois processos gerais para a preparação de derivados da acilsulfamoilbenzamida são descritos na WO 99/16744.

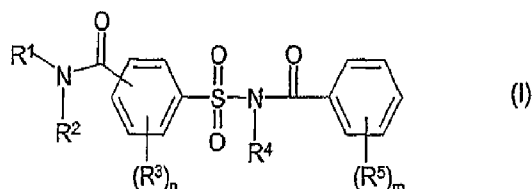
25 O primeiro processo descrito envolve a acilação de uma acilsulfamoilbenzamida utilizando um halogeneto do ácido benzóico, um anidrido ou uma carbonilimidazolida ou utilizando um ácido benzóico e um agente de acoplamento tal como a N,N-diciclohexilcarbodiimida. São descritos aqui vários exemplos específicos deste processo, que são realizados através do aquecimento de uma mistura de um ácido benzóico com a sulfamoilbenzamida, o 1,1'-carbodildiimidazol e o 1,8-diazabicyclo [5.4.0] undec-7-eno (DBU)
30 em tetrahidrofurano. Entretanto, este procedimento tem valor limitado para

operações em grande escala ou industriais por causa dos rendimentos moderados obtidos, assim como o 1,1'-carbonyldiimidazol caro de forma proibitiva que adicionalmente dá origem a subprodutos substanciais de rejeito.

O segundo processo geral descrito na referência acima envolve a reação de um derivado do ácido acilsulfamoilbenzóico com uma amina, mas este método não é especificamente exemplificado na mesma. Uma desvantagem desta abordagem é que os procedimentos para a preparação do derivado do ácido acilsulfamoilbenzóico, tal como o derivado do cloreto ácido, são geralmente ineficientes uma vez que muitas etapas de reação estão envolvidas, levando a rendimentos globais fracos ou moderados.

Com a finalidade de superar as limitações anteriores dos processos conhecidos, foi desenvolvido agora um novo processo em duas etapas para a preparação de compostos da acilsulfamoilbenzamida, que envolve um número reduzido de etapas de reação e que pode ser aplicado em processos em escala industrial.

De acordo com a presente invenção é fornecido um processo para a preparação de um composto da fórmula geral (I):



em que:

R^1 é hidrogênio, $-(CH_2)_p$ -heterociclila ou um radical de hidrocarboneto, em que os dois radicais mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, ciano e nitro;

R^2 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquínila, (C_1-C_6) -alcóxi, (C_2-C_6) -alquenilóxi, em que os cinco radicais mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_4) -alcóxi e (C_1-C_4) -alquiltio; ou

R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio de ligação formam um anel saturado ou insaturado de 3 até 8 membros;

R^3 e R^5 são cada um independentemente halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_6)-alquila, (C_1-C_6) -alquilcarbonila, -CO-arila, ciano ou nitro; ou dois grupos R^5 adjacentes formam uma porção -O-CH₂CH₂-;

R^4 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila ou (C_2-C_6) -alquinila;

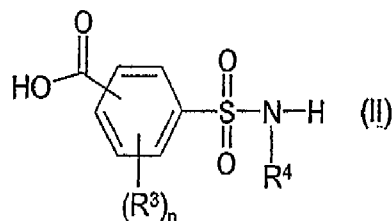
n é um número inteiro de 0 até 4;

10 m é um número inteiro de 0 até 5;

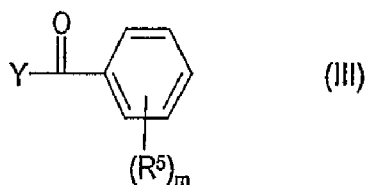
p é 0 ou 1; e

q é 0, 1 ou 2; ou um sal do mesmo; cujo processo compreende:

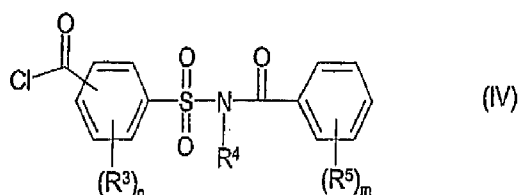
a) a reação de um composto da fórmula geral (II):



em que R^3 , R^4 e n são como definidos na fórmula (I), com um composto da
15 fórmula (III):



em que R^5 e m são como definidos na fórmula (I) e Y é OH ou Cl, na presença de um agente de cloração, para fornecer um composto da fórmula (IV):



em que R^3 , R^4 , R^5 , m e n são como definidos na fórmula (I) e

b) a reação do composto da fórmula (IV) obtido na etapa a) com um composto da fórmula (V):

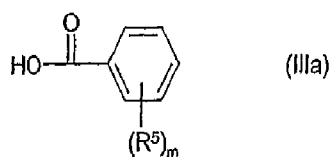


em que R^1 e R^2 são como definidos na fórmula (I).

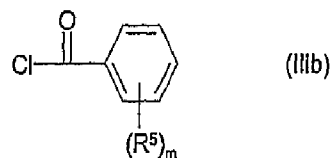
5 O agente de cloração utilizado no processo é preferencialmente selecionado de um agente de cloração com base em enxofre ou fósforo tal como o cloreto de tionila, o oxícloreto de fósforo ou o pentacloreto de fósforo e um agente de cloração com base em carbono utilizado para a conversão de um ácido carboxílico no cloreto ácido correspondente, tal como o cloreto de oxalila ou o fosfogênio. O agente de cloração preferido é o cloreto de tio-
10 nila.

A quantidade de agente de cloração utilizada possui uma influência sobre o rendimento do produto da fórmula (IV) e pode ser otimizada com a finalidade de teste preliminar dependendo do solvente, da quantidade e do tipo de material de partida entre outros fatores. Na maioria dos casos, a
15 quantidade fica entre ligeiramente abaixo da quantidade estequiométrica até um excesso.

A quantidade de agente de cloração utilizada depende da definição de Y na fórmula (III), por exemplo, quando Y for compostos com OH da
20 fórmula (IIIa):



são utilizados como o material de partida. Alternativamente, quando Y for compostos de Cl da fórmula (IIIb):



são utilizados.

Quando Y for OH, a quantidade de agente de cloração utilizada
25 é preferencialmente de 1 até 2 equivalentes molares por equivalente de grupos carboxílicos dos compostos (II) e (IIIa), mais preferencialmente de 1,1

até 2 equivalentes molares por equivalentes de (II) e de (III), mais preferencialmente de 1,2 até 1,9 equivalente molar por equivalentes de (II) e de (III). Quando Y for Cl, a quantidade de agente de cloração utilizada é preferencialmente de 1 até 2 equivalentes molares por equivalente do composto (II),
5 mais preferencialmente de 1,1 até 2 equivalentes molares por equivalente de (II), mais preferencialmente de 1,2 até 1,9 equivalente molar por equivalente de (II).

Na etapa de reação a) o composto da fórmula (IV) pode ser isolado através de métodos comuns ou costumeiros, por exemplo, preferencialmente, através da evaporação parcial durante a qual este precipita e pode
10 ser extraído por filtração.

Em uma característica adicional da invenção o agente de cloração em excesso não reagido, que no caso do cloreto de tionila está presente no destilado, pode ser reciclado.

A proporção de (II):(IIIa) é preferencialmente de 1:1, mas em alguns casos é benéfica para adicionar um excesso ligeiro (até 10%) do ácido (IIIa), que possui a vantagem de garantir uma conversão mais completa do ácido (II) na reação. Esta variação é preferencialmente utilizada se o cloreto ácido correspondente da fórmula (IIIb) permanecer solúvel na mistura de
15 reação após a evaporação parcial, uma vez que a separação partindo do produto desejado precipitado (IV) é então efetuada.

Um catalisador tal como uma N,N-dialquilacilamida, por exemplo, a N,N-dimetilformamida ou a N,N-dibutilformamida ou uma amina cíclica tal como a piridina ou a quinolina está também opcionalmente presente na
20 mistura de reação.

A reação pode ser realizada na ausência ou preferencialmente na presença de um solvente estável e inerte, que pode ser um solvente orgânico não polar ou polar que essencialmente não reage com o agente de cloração ou com os compostos (III) ou (IV) na mistura de reação. Este é, por
25 exemplo, um solvente orgânico não polar que é preferencialmente selecionado de

- hidrocarbonetos alifáticos ou aromáticos tais como alcanos,

por exemplo, heptano, octano ou um benzeno alquilado tal como o tolueno, os dimetilbenzenos (xilóis) ou os trimetilbenzenos ou o óleo de parafina,

- hidrocarbonetos alifáticos halogenados tais como o diclorometano ou os hidrocarbonetos aromáticos halogenados tais como o clorobenzeno ou o diclorobenzeno ou os haloalquilbenzenos tais como o benzotri-fluoreto e

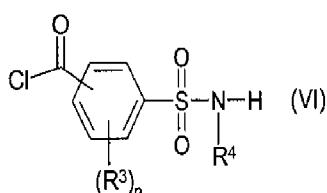
- óleos de silício.

Os solventes mais preferidos são o clorobenzeno e o tolueno.

A temperatura de reação na etapa a) pode variar dentro de limites amplos dependentes do solvente e da pressão utilizados. Por exemplo, a temperatura de reação é de 70°C até 140°C, preferencialmente de 80°C até 130°C, mais preferencialmente de 80°C até 115°C.

A etapa de reação a) prossegue geralmente em um rendimento excelente, com rendimentos típicos do composto da fórmula (IV) em um excesso de 90% ou até mesmo 95%. A pureza do composto da fórmula (IV) é geralmente muito alta (tipicamente de pelo menos 95%).

O derivado do cloreto ácido da fórmula (IIIb) acima é formado na forma de um intermediário na reação preferida em que o composto da fórmula (IIIa) é utilizado como o material de partida e acila a porção sulfamoila do composto da fórmula (II) e/ou seu derivado do cloreto ácido da fórmula (VI):



Em contraste com a preparação mencionada anteriormente dos cloretos do ácido acilsulfamoil benzóico dos ácidos benzóicos correspondentes da fórmula (III) através da cloração separada do composto da fórmula (II), subprodutos dimérico indesejáveis são essencialmente evitados no processo da invenção.

A reação do composto da fórmula (IV) com o composto da fórmula (V) na etapa b) pode ser realizada com ou sem uma base adicional. Preferencialmente é utilizada uma base adicional em cujo caso pode ser

uma base inorgânica tal como um hidróxido ou um alcóxido de metal alcalino, por exemplo, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio ou metóxido de sódio ou um carbonato de metal alcalino tal como o carbonato de potássio, o carbonato de sódio ou o carbonato de lítio ou um bicarbonato de metal alcalino tal como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio ou um alcenoato de metal alcalino tal como um acetato de sódio ou um hidróxido, um carbonato ou um bicarbonato de metal alcalino ou uma base orgânica tal como uma trietilamina, por exemplo, a trietilamina ou a tributilamina ou a N-dialquilanilina tal como a dimetilalanilina.

10 A base adicional preferida é a trietilamina, o carbonato de potássio ou o carbonato de sódio.

A quantidade de base adicional utilizada pode geralmente ser variada dentro dos limites amplos e otimizada através do teste preliminar. Preferencialmente a proporção de equivalentes molares de base adicional em relação aos equivalentes molares do composto da fórmula (IV) é de 1,2:1 até 1:1,2, mais preferencialmente quantidades equimolares de base e do composto (IV).

A quantidade de amina (V) utilizada é preferencialmente um pequeno excesso em relação à quantidade de (IV), tipicamente de aproximadamente 1,05 equivalente molar de (V) para 1 equivalente molar de (IV). É também possível utilizar 2 equivalentes molares do composto da fórmula (V) em que um equivalente molar é utilizado como a base na reação.

A etapa b) do processo é tipicamente realizada na presença e na ausência de um solvente. Quando um solvente é utilizado, uma ampla variedade de solventes polares ou não polares pode ser empregada, contanto que não reajam substancialmente com o composto da fórmula (IV). Vários solventes podem ser utilizados, por exemplo, hidrocarbonetos aromáticos tais como um benzeno alquilado, por exemplo, tolueno ou nitrilas tais como cianoalcanos, por exemplo, a acetonitrila ou os hidrocarbonetos halogenados tais como os haloalcanos, por exemplo, o diclorometano ou os compostos aromáticos halogenados tais como os halobenzenos, por exemplo, o clorobenzeno ou éteres tais como éteres dialquílicos, por exemplo, o éter dietí-

lico ou diglima ou éteres cíclicos tais como o tetrahydrofurano ou o dioxano, ou uma N,N-dialquilacilamida tal como a N,N-dimetilformamida, ou a N,N-dimetilacetamida ou uma N-alquilpirrolidinona tal como a N-metilpirrolidinona. Os solventes de nitrila são preferidos, mais particularmente a acetonitrila.

5 A temperatura de reação para a etapa b) é preferencialmente de 0°C até 150°C, mais preferencialmente de 0°C até 60°C, mais preferencialmente de 10°C até 20°C.

 O produto da fórmula (I) pode ser isolado de uma maneira simples, por exemplo, através da diluição da mistura de reação com água, seguida pela acidificação com, por exemplo, um ácido mineral tal como o ácido clorídrico e pela filtração.

10

 O rendimento isolado do composto da fórmula (I) é geralmente muito alto, em um excesso de 90% ou até mesmo de 95%. O produto é geralmente obtido em alta pureza, tipicamente de pelo menos 95%.

15 O processo da invenção, dependendo do agente de cloração, pode também ser realizado na forma de um procedimento de um recipiente. Nesta variação, a etapa de reação a) é preferencialmente seguida pela remoção (por exemplo, através da evaporação) do restante do agente de cloração, seguida no mesmo recipiente pela etapa de reação b).

20 Em uma característica adicional da invenção é fornecido um processo para a preparação de um composto da fórmula (IV) como definido anteriormente, através da reação de um composto da fórmula (II) como definido anteriormente, com um composto da fórmula (III), preferencialmente o composto (IIIa) como definido anteriormente, na presença de um agente de cloração como definido anteriormente (preferencialmente, o cloreto de tionila).

25

 Em uma característica adicional da invenção é fornecido um processo para a preparação de um composto da fórmula (IV) como definido anteriormente, através da reação de um composto da fórmula (II) como definido anteriormente, com um composto da fórmula (IIIb) como definido anteriormente na presença de um agente de cloração como definido anteriormente (preferencialmente, o cloreto de tionila).

30

Em uma característica adicional da invenção é fornecido um processo para a preparação de um composto da fórmula (I) como definido anteriormente, através da reação de um composto da fórmula (IV) como definido anteriormente, com um composto da fórmula (V) como definido anteriormente:

Na fórmula (I) e em todas as fórmulas aqui acima e aqui abaixo, os termos mencionados possuem os significados descritos abaixo:

O termo "halogênio" inclui floro, cloro, bromo e iodo.

O termo "(C₁-C₄)-alquila" deve ser entendido como um radical de hidrocarboneto de cadeia reta ou ramificada que possui 1, 2, 3 ou 4 átomos de carbono, por exemplo, o radical metila, etila, propila, isopropila, 1-butila, 2-butila, 2-metilpropila ou terc-butila. De forma correspondente, os radicais alquila que possuem uma faixa maior de átomos de carbono devem ser entendidos como radicais de hidrocarboneto saturados de cadeia reta ou ramificada que contêm um número de átomos de carbono que corresponde a esta faixa. O termo "(C₁-C₆)-alquila" inclui assim os radicais alquila mencionados anteriormente e ainda, por exemplo, o radical pentila, 2-metilbutila, 1,1-dimetilpropila e hexila.

"(C₁-C₄)-haloalquila" ou "(C₁-C₆)-haloalquila" deve se entendido como um grupo alquila mencionado sob o termo "(C₁-C₄)-alquila" ou "(C₁-C₆)-alquila" respectivamente em que um ou mais átomos de hidrogênio são substituídos pelo número correspondente de átomos de halogênio idênticos ou diferentes, preferencialmente cloro ou flúor, tal como o grupo trifluorometila, o 1-fluoroetila, o 2,2,2-trifluoroetila, o clorometila, o fluorometila, o difluorometila e o 1,1,2,2-tetrafluoroetila.

"(C₁-C₄)-alcóxi" ou "(C₁-C₆)-alcóxi" deve ser entendido como um grupo alcóxi cujo radical de hidrocarboneto tem o significado sob o termo "(C₁-C₄)-alquila" ou "(C₁-C₆)-alquila" respectivamente. Os grupos alcóxi que envolvem uma faixa maior de átomos de carbono devem ser similarmente entendidos.

Os termos "alquenila" e "alquinila" que possuem um prefixo que indica uma faixa de átomos de carbono significam um radical de hidrocarbo-

neto de cadeia reta ou de cadeia ramificada que possui um número de átomos de carbono que corresponde a esta faixa, este radical de hidrocarboneto possuindo pelo menos uma ligação múltipla que pode estar em qualquer posição do radical insaturado em questão. "(C₂-C₆)-alquenila" significa assim, por exemplo, o grupo vinila, alila, 2-metil-2-propenila, 2-butenila, pentenila, 2-metilpentenila ou hexenila. "(C₂-C₆)-alquinila" significa, por exemplo, o grupo etinila, propargila, 2-metil-2-propinila, 2-butinila, 2-pentinila e 2-hexinila.

"(C₃-C₈)-cicloalquila" significa radicais de alquila monocíclicos, tais como o radical ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila, cicloheptila ou ciclooctila e radicais alquila bicíclicos, tal como o radical norbornila.

"(C₃-C₈)-cicloalcóxi" ou "(C₃-C₈)-cicloalquiltio" deve ser entendido como um dos radicais (C₃-C₈)-cicloalquila mencionados anteriormente que é ligado através de um átomo de oxigênio ou de enxofre.

"(C₁-C₄)-alquiltio" ou "(C₁-C₆)-alquiltio" respectivamente são um grupo alquiltio cujo radical de hidrocarboneto possui o significado sob o termo "(C₁-C₄)-alquila" ou "(C₁-C₆)-alquila".

Outros termos compósitos, tais como (C₃-C₆)-cicloalquenila, devem ser entendidos de forma correspondente, de acordo com as definições anteriores.

O termo "arila" deve ser entendido como um radical aromático isocíclico, mono-, bi- ou policíclico que possui preferencialmente 6 até 14, em particular 6 até 12, átomos de carbono, tais como fenila, naftila ou bifenila, preferencialmente fenila.

O termo "heterociclila" significa um radical mono- ou bicíclico que é completamente saturado, parcialmente ou completamente insaturado e que contém um até cinco átomos idênticos ou diferentes selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, enxofre e oxigênio, em que, entretanto, dois átomos de oxigênio podem não estar diretamente adjacentes e pelo menos um átomo de carbono tem de estar presente no anel, por exemplo um radical tienila, furila, pirrolila, tiazolila, oxazolila, imidazolila, isotiazolila, isoxazolila, pirazolila, 1,3,4-oxadiazolila, 1,3,4-tiadiazolila, 1,3,4-triazolila,

1,2,4-oxadiazolila, 1,2,4-tiadiazolila, 1,2,4-triazolila, 1,2,3-triazolila, 1,2,3,4-tetrazolila, benzo [b] tienila, benzo [b] furila, indolila, benzo [c] tienila, benzo [c] furila, isoindolila, benzoxazolila, benzotiazolila, benzimidazolila, benzisoxazolila, benzisotiazolila, benzopirazolila, benzotiadiazolila, benzotriazolila, 5 dibenzofurila, dibenzotienila, carbazolila, piridila, pirazinila, pirimidinila, piridazinila, 1,3,5-triazinila, 1,2,4-triazinila, 1,2,4,5-tetrazinila, quinolinila, isoquinolinila, quinoxalinila, quinazolinila, 1,8-naftiridinila, 1,5-naftiridinila, 1,6-naftiridinila, 1,7-naftiridinila, ftalazinila, piridopirimidinila, purinila, pteridinila, piperidinila, pirrolidinila, oxazolinila, tetrahidrofurila, tetrahidropiranila, isoxazolidinila ou tiazolidinila. 10

Um "radical de hidrocarboneto" é um radical de hidrocarboneto de cadeia reta, ramificada ou cíclica que pode ser saturado, parcialmente saturado, insaturado ou aromático, por exemplo, alquila, alquenila, alquinila, cicloalquila, cicloalquenila, cicloalquilalquila, arila ou CH_2arila , preferencialmente alquila, alquenila e alquinila possuindo até 20 átomos de carbono ou 15 cicloalquila possuindo 3 até 6 átomos do anel ou fenila.

Nos casos em que dois ou mais radicais R^3 e/ou R^5 estão presentes, isto é, se m e/ou n forem maiores que um, estes radicais podem em cada caso ser idênticos ou diferentes.

20 Se R^1 na fórmula (I) for um radical de hidrocarboneto, este radical de hidrocarboneto possui preferencialmente até 20 átomos de carbono. Se este radical de hidrocarboneto carregar substituintes adicionais contendo carbono, o número total de todos os átomos de carbono deste radical R^1 é preferencialmente de 2 até 30.

25 Dependendo do tipo e da ligação dos substituintes, os compostos da fórmula (I) podem estar presentes na forma de estereoisômeros. Se, por exemplo, um ou mais grupos alquenila estiverem presentes, podem ocorrer diastereoisômeros. Se, por exemplo, um ou mais átomos de carbono assimétricos estiverem presentes, os enantiômeros e os diastereoisômeros 30 podem ocorrer. Os estereoisômeros podem ser obtidos das misturas que são obtidas na preparação através de métodos costumeiros de separação, por exemplo, através de processos de separação cromatográficos. É tam-

bém possível preparar estereoisômeros de forma seletiva através do emprego de reações estereosseletivas utilizando materiais de partida opticamente ativos e/ou auxiliares. O processo se refere assim a todos os estereoisômeros e às misturas dos mesmos que são abrangidos pela fórmula (I), mas não
5 definidos especificamente.

Os compostos da fórmula (I) podem formar sais. A formação de sais pode ocorrer através da ação de uma base sobre estes compostos da fórmula (I) que carregam um átomo de hidrogênio ácido, por exemplo, no caso de $R^4 = H$. As bases adequadas são, por exemplo, aminas orgânicas e
10 também hidróxidos, carbonatos e bicarbonatos de amônio, de metais alcalinos ou de metais alcalino-terrosos, em particular hidróxido de sódio e hidróxido de potássio, carbonato de sódio e carbonato de potássio e bicarbonato de sódio e bicarbonato de potássio. A formação de sais pode também ocorrer através da adição de um ácido nos grupos básicos, em que um grupo
15 heterociclila está presente e representa um grupo básico tal como imidazolila ou piridila. Os ácidos que são adequados para esta finalidade são os ácidos inorgânicos e orgânicos, por exemplo, HCl, HBr, H_2SO_4 , HNO_3 ou H_3PO_4 ou o ácido acético, o ácido trifluoroacético ou o ácido oxálico ou os ácidos sulfônicos e o processo da invenção inclui a formação de tais sais.

20 Preferencialmente R^1 é hidrogênio, (C_1-C_{12}) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquinila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, arila, $-CH_2$ -arila ou $-(CH_2)_p$ -heterociclila em que heterociclila é um anel de 3 até 8 membros que possui até três heteroátomos idênticos ou diferentes selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os
25 oito radicais mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, ciano e nitro.

Preferencialmente também R^1 é hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_5-C_6) -cicloalquenila,
30 fenila ou $-(CH_2)_p$ -heterociclila em que heterociclila é um anel de 3 até 6 membros que possui até três heteroátomos selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os sete radicais menciona-

dos por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais substituintes selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila e (C₁-C₆)-alcóxi.

Preferencialmente ainda R¹ é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₆)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, -CH₂furila, fenila, -CH₂fenila ou -CH₂CH₂fenila, cujos os três radicais fenila mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais de halogênio.

Preferencialmente ainda R¹ é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₅-C₆)-cicloalquenila, fenila ou heterociclila de 3 até 6 membros que possui até três heteroátomos selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os seis radicais mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais substituintes selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila e (C₁-C₄)-alcóxi.

Preferencialmente R² é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila ou (C₁-C₆)-alcóxi em que os dois radicais mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio e (C₁-C₄)-alcóxi.

Preferencialmente ainda R² é hidrogênio ou (C₁-C₆)-alquila ou (C₁-C₆)-haloalquila.

Preferencialmente ainda R² é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila ou (C₂-C₆)-alquinila.

Preferencialmente ainda R¹ e R² juntos formam a porção -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-, -(CH₂)₄- ou -(CH₂)₅-.

Preferencialmente R³ e R⁵ são cada um independentemente, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, S(O)_q-(C₁-C₆)-alquila, ciano ou nitro ou R⁵ é -CO-arila ou dois grupos R⁵ adjacentes formam a porção -O-CH₂CH₂-.

Preferencialmente ainda R³ e R⁵ são cada um independentemente halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi, S(O)_q-(C₁-C₄)-alquila, ciano ou nitro ou R⁵ é -CO-arila ou dois grupos R⁵ adjacentes

formam a porção $-O-CH_2CH_2-$.

Preferencialmente ainda R^3 e R^5 são cada um independentemente halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, ciano ou nitro ou R^5 é $-CO$ -arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção
5 $-O-CH_2CH_2-$.

Preferencialmente, cada R^3 é, independentemente, halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_4)-alquila, ciano ou nitro.

Mais preferencialmente, cada R^3 independentemente, é halogênio,
10 nio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, ciano ou nitro.

Mais preferencialmente, R^3 é halogênio ou nitro.

Preferencialmente R^4 é hidrogênio ou (C_1-C_6) -alquila.

Mais preferencialmente R^4 é hidrogênio ou (C_1-C_4) -alquila.

Mais preferencialmente R^4 é hidrogênio.

Preferencialmente, cada R^5 é, independentemente, halogênio,
15 (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_6)-alquila, ciano, nitro, $-CO$ -arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção $-O-CH_2CH_2-$, mais preferencialmente é halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -alcóxi, nitro ou $-CO$ -naftila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção
20 $-O-CH_2CH_2-$.

Mais preferencialmente, cada R^5 é independentemente halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_4)-alquila, ciano, nitro ou $-CO$ -arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção $-O-CH_2CH_2-$, mais preferencialmente é halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, nitro ou $-CO$ -naftila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção
25 $-O-CH_2CH_2-$.

Preferencialmente ainda R^5 é cada um independentemente halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, ciano ou nitro, mais preferencialmente halogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_1-C_4) -alcóxi, ciano ou nitro,
30 mais preferencialmente (C_1-C_4) -alcóxi.

Preferencialmente n é 0, 1 ou 2, mais preferencialmente 0.

Preferencialmente m é 0, 1 ou 2, mais preferencialmente 1 ou 2,

em particular 1.

Os compostos preferidos da fórmula (I) são aqueles em que:

R^1 é hidrogênio, (C_1-C_{12}) -alquila, (C_2-C_8) -alquenila, (C_2-C_8) -alquini-
nila, (C_3-C_8) -cicloalquila, (C_3-C_8) -cicloalquenila, arila, $-CH_2$ arila ou $-(CH_2)_p$ -
5 heterociclila em que heterociclila é um anel de 3 até 8 membros que possui
até três heteroátomos idênticos ou diferentes selecionados do grupo que
consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os oito radicais mencio-
nados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais
radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alquila,
10 (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, ciano e nitro;

R^2 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila ou (C_1-C_6) -alcóxi em que os dois
radicais mencionados por último são não substituídos ou são substituídos
por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio e
 (C_1-C_4) -alcóxi;

15 R^3 e R^5 são cada um, independentemente, halogênio, (C_1-C_6) -
alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_6)-alquila, ciano ou
nitro ou R^5 é $-CO$ -arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção
 $-O-CH_2CH_2-$; e

R^4 é hidrogênio ou (C_1-C_6) -alquila.

20 Os compostos adicionalmente preferidos da fórmula (I) são
aqueles em que:

R^1 é hidrogênio, (C_1-C_8) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alqui-
nila, (C_3-C_6) -cicloalquila, (C_5-C_6) -cicloalquenila, fenila ou $-(CH_2)_p$ -heterociclila
em que heterociclila é um anel com 3 até 6 membros que possuem até três
25 heteroátomos selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e
enxofre, em que os sete radicais mencionados por último são não substituí-
dos ou são substituídos por um ou mais substituintes selecionados do grupo
que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila e (C_1-C_6) -
alcóxi;

30 R^2 é hidrogênio ou (C_1-C_6) -alquila ou (C_1-C_6) -haloalquila;

R^3 e R^5 são cada um, independentemente, halogênio, (C_1-C_4) -
alquila, (C_1-C_4) -haloalquila, (C_1-C_4) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_4)-alquila, ciano ou

nitro ou R^5 é -CO-arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção -O-CH₂CH₂-; e

R^4 é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila.

São ainda preferidos os compostos da fórmula (I) em que:

5 R^1 é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₂-C₆)-alquinila, (C₁-C₆)-alcóxi-(C₁-C₆)-alquila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₃-C₆)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquila, -CH₂furila, fenila, -CH₂fenila ou -CH₂CH₂fenila, cujos três radicais fenila mencionados por último não são substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais de halogênio;

10 R^2 é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila ou (C₂-C₆)-alquinila;
ou R^1 e R^2 juntos formam a porção -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-, -(CH₂)₄- ou -(CH₂)₅-;

R^3 é halogênio ou nitro;

R^4 é hidrogênio ou (C₁-C₄)-alquila;

15 R^5 é halogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-haloalquila, (C₁-C₆)-alcóxi, S(O)_q-(C₁-C₆)-alquila, ciano, nitro, -CO-arila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção -O-CH₂CH₂-, mais preferencialmente é halogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₁-C₆)-alcóxi, nitro ou -CO-naftila ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção -O-CH₂CH₂-;

20 n é 0, 1 ou 2; e

m é 0, 1 ou 2, mais preferencialmente 1 ou 2.

Os compostos adicionalmente preferidos da fórmula (I) são aqueles em que:

25 R^1 é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila, (C₂-C₆)-alquenila, (C₃-C₆)-cicloalquila, (C₅-C₆)-cicloalquenila, fenila ou heterociclila de 3 até 6 membros que possui até três heteroátomos selecionados do grupo que consiste em nitrogênio, oxigênio e enxofre, em que os seis radicais mencionados por último são não substituídos ou são substituídos por um ou mais substituintes selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C₁-C₄)-alquila, (C₁-C₄)-haloalquila e (C₁-C₄)-alcóxi;

30

R^2 é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila ou (C₁-C₆)-haloalquila;

R^3 e R^5 são cada um, independentemente, halogênio, (C₁-C₄)-

alquila, (C₁-C₄)-haloalquila, (C₁-C₄)-alcóxi, ciano ou nitro;

R⁴ é hidrogênio;

n é 0, 1 ou 2; e

m é 0, 1 ou 2, mais preferencialmente 1 ou 2.

- 5 Os compostos particularmente preferidos da fórmula (I) são aqueles em que:

R¹ é hidrogênio, (C₁-C₆)-alquila ou (C₃-C₆)-cicloalquila;

R² e R⁴ são cada um hidrogênio;

R⁵ é (C₁-C₆)-alcóxi;

- 10 n é 0;

m é 0 ou 1; mais preferencialmente 1.

e o grupo sulfamoila fica localizado para a porção CONR¹R² no anel fenila.

- São ainda preferidos os processos para a preparação das fórmulas (Ia), (Ib), (Ic), (IVa), (IVb) e (IVc) como mostrado e definido nas tabelas 1 até 6 abaixo, em que os radicais R¹, R², R³, R⁴, R⁵ e n são como definidos anteriormente e preferencialmente têm os significados preferidos anteriores.

Os compostos da fórmula (IV) são novos e formam uma característica adicional da invenção.

- 20 Os compostos das fórmulas (II), (III), (V) e (VI) são conhecidos ou podem ser preparados através de métodos conhecidos.

- Comparada com o processo conhecido, a presente invenção fornece um processo global para a preparação de acilsulfamoilbenzamidas que possuem menos etapas de reação e fornecem rendimentos maiores e um produto com pureza maior.

Os exemplos não limitantes a seguir ilustram a invenção.

As quantidades, as quantidades relativas, as porcentagens ou as proporções se referem ao peso a não ser que seja especificamente fornecida uma outra definição.

- 30 Exemplo 1

Cloreto de 4- [[(2-Metóxi-5-clorobenzoil)amino] sulfonil] benzoila

Uma mistura do ácido 4-aminossulfonilbenzóico (1 mol), do ácido

2-metóxi-5-clorobenzóico (1 mol) e o cloreto de tionila (2,5 moles) em cloro-
benzeno (700 mL) foi aquecida a 120°C durante 7-9 horas. Após a reação
ter sido completada 200 mL do solvente foram removidos a vácuo. A mistura
foi resfriada e o precipitado foi extraído por filtração e lavado com heptano
5 para fornecer o composto do título, pf. 138-140°C, rendimento de 93% em
teoria.

O cloreto de 4-[[[(Benzoil) amino] sulfonyl] benzoila foi preparado
de uma maneira similar partindo do ácido 4-aminossulfonylbenzóico e do áci-
do benzóico, pf. 180-182°C, rendimento de 96% em teoria.

10 O cloreto de 4-[[[(2-Clorobenzoil) amino] sulfonyl] benzoila foi pre-
parado de uma maneira similar partindo do ácido 4-aminossulfonylbenzóico e
do ácido 2-clorobenzóico, pf. 198-200°C, rendimento de 95% em teoria.

Exemplo 2

N,N-Dietil-4-[[[(2-metoxibenzoil) amino] sulfonyl] benzamida

15 A uma suspensão do cloreto de 4-[[[(2-metóxi-benzoil) amino] sul-
fonyl] benzoila (1 mol) e de dietilamina (1 mol) em acetonitrila (1000 mL), foi
adicionada trietilamina (1 mol) a 10°C. A mistura foi agitada durante 2 horas
a 20°C e diluída com água (500 mL). O precipitado branco foi extraído por
filtração, lavado e seco para fornecer o composto do título. O rendimento do
20 produto obtido era de 98% em teoria e a pureza de 98%.

Exemplo 3

N-Ciclopropil-4-[[[(2-clorobenzoil) amino] sulfonyl] benzamida

Empregando o procedimento descrito no exemplo 2, mas utili-
zando carbonato de potássio (1 equivalente) ao invés da trietilamina, foi ob-
25 tido o composto do título em um rendimento de 99% em teoria.

Nas tabelas 1 até 3 abaixo está listado um número de exemplos
dos composto da fórmula (I) que são preparados através do processo da
invenção.

As abreviações nas tabelas 1 até 6 significam:

30	Bu = n-butila	Et = etila
	Me = metila	c = ciclo
	Pr = n-propil	s = secundário

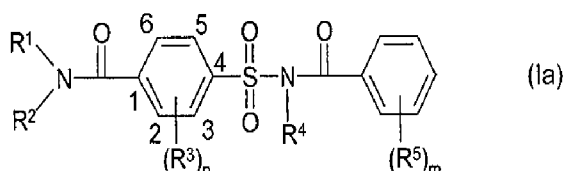
i = iso

Mp = ponto de fusão

t = terciário

Se um radical alquila estiver listado nas tabelas sem qualquer especificação adicional, este radical alquila tem cadeia reta.

5 Tabela 1: Compostos da fórmula (Ia)



Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
1-1	Et	Et	-	H	2-OMe	94-98	
1-2	Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Me	92-96	196
1-3	Bu	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	86-90	
1-4	Bu	H	-	H	2,5-(Me) ₂	83-87	
1-5	Bu	H	-	H	2,3-(Me) ₂	86-90	
1-6	Bu	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	76-80	
1-7	Bu	H	-	Me	2-OMe	85-89	
1-8	Bu	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	81-85	
1-9	Bu	H	-	Me	2-Cl	86-90	
1-10	Et	Et	-	Me	2-OMe, 5-Cl	93-97	
1-11	Bu	H	2-NO ₂	H	2-OMe	93-97	
1-12	Bu	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-13	Bu	H	2-NO ₂	H	2-Cl	93-97	
1-14	Bu	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Cl	81-85	
1-15	Pr	H	-	H	2-OMe		
1-16	Pr	H	-	H	2-Me	93-97	120
1-17	Pr	H	-	H	2-Cl		
1-18	Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-19	Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-20	Pr	H	-	H	2,3-(Me) ₂		
1-21	Pr	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
1-22	Pr	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
1-23	Pr	H	2-NO ₂	H	2,3-(Me) ₂	93-97	
1-24	Pr	H	2-NO ₂	H	2-OMe	93-97	197
1-25	Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Cl		
1-26	Pr	H	-	Me	2,3-(Me) ₂	81-85	
1-27	Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me		
1-28	Pr	H	-	Me	2-OMe	93-97	
1-29	Pr	H	2-NO ₂	Me	2-OMe, 5-Me		
1-30	alila	H	2-NO ₂	H	2-OMe	81-85	

Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
1-31	alila	H	-	Me	2,5-(Me) ₂		
1-32	alila	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	93-97	
1-33	alila	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
1-34	alila	Alila	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-35	alila	Alila	-	H	2-Cl		
1-36	alila	Me	-	H	2-Me		
1-37	alila	Me	-	H	2-OMe		
1-38	alila	Me	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-39	alila	Me	-	H	2-OMe, 5-Cl	93-97	214
1-40	Alila	Me	-	H	2,3-(Me) ₂		
1-41	c-hexila	H	-	H	2-Cl	93-97	
1-42	c-hexila	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-43	c-pentila	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-44	c-pentila	H	-	Me	2-OMe, 5-Me	93-97	
1-45	c-Pr	H	-	H	2-OMe	96-100	217
1-46	c-Pr	H	-	H	2-Cl	96-100	207
1-47	c-Pr	H	-	H	2-Me	88-92	226
1-48	c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me	88-92	211
1-49	c-Pr	H	-	H	2,3-(Me) ₂	88-92	233
1-50	c-Pr	H	-	H	2,5-(Me) ₂	93-97	225
1-51	c-Pr	H	-	Me	2-OMe	88-92	70
1-52	c-Pr	H	-	Me	2-Me	92-96	122
1-53	c-Pr	H	-	Me	2,5-(Me) ₂	92-96	
1-54	c-Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me		
1-55	c-Pr	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-56	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-Cl	92-96	138
1-57	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-OMe		
1-58	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-Me	92-96	162
1-59	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-OMe		
1-60	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-Cl	92-96	163
1-61	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-62	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2,5- Cl ₂	92-96	185
1-63	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2,3-(Me) ₂		
1-64	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	H	2-OMe, 5-Cl	92-96	193
1-65	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	Me	2,3-(Me) ₂	92-96	
1-66	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	Me	2-Me	91-95	
1-67	C ₂ H ₄ -OEt	H	-	Me	2-OMe, 5-Me		
1-68	C ₃ H ₆ -OMe	H	-	H	2-Me	92-96	93
1-69	C ₃ H ₆ -OMe	H	-	H	2-Cl		
1-70	CH ₂ -2-furanila	H	-	H	2-Me	92-96	205

Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
1-71	CH ₂ -2-furanila	H	-	H	2-OMe	91-95	190
1-72	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2,5- Cl ₂	91-95	209
1-73	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-74	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2-Me		
1-75	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-76	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-77	CH ₂ -c-Pr	H	-	H	2-Cl		
1-78	CH ₂ C≡CH	H	-	H	2,5- Cl ₂	92-96	175
1-79	CH ₂ C≡CH	H	-	Me	2,5-(Me) ₂	88-92	185
1-80	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	-	Me	2-OMe, 5-Me	88-92	
1-81	CH ₂ -t-Bu	H	-	H	2-Cl	88-92	213
1-82	CH ₂ -t-Bu	H	-	H	2-OMe		
1-83	CH ₂ -t-Bu	H	-	H	2-Me		
1-84	CH ₂ CH(OMe) ₂	H	-	H	2-OMe		
1-85	CH ₂ CH(OMe) ₂	H	-	H	2-Me	88-92	140
1-86	Et	Et	-	H	2-OMe		
1-87	Et	Et	-	H	2-Cl		
1-88	Et	Et	-	H	2,5- Cl ₂	88-92	155
1-89	Et	Et	-	H	2-OMe	88-92	
1-90	Et	H	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-91	Et	H	-	H	2,3-(Me) ₂	88-92	
1-92	Et	H	-	Me	2-OMe		
1-93	Et	H	-	Me	2-OMe, 5-Me		
1-94	Et	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me	88-92	
1-95	i-Bu	H	-	H	2-OMe		
1-96	i-Bu	H	-	H	2-Me	88-92	150
1-97	i-Bu	H	-	H	2-Cl		
1-98	i-Bu	H	-	H	2,3-(Me) ₂		
1-99	i-Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-100	i-Bu	H	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-101	i-Pr	H	-	H	2-Me	88-92	200
1-102	i-Pr	H	-	H	2-OMe		
1-103	i-Pr	H	-	H	2-Cl		
1-104	i-Pr	H	-	H	2,4- Cl ₂	88-92	258
1-105	i-Pr	H	-	H	2,5- Cl ₂		
1-106	i-Pr	H	-	Me	2-OMe, 5-Me		
1-107	i-Pr	H	-	Me	2,5-(Me) ₂		
1-108	i-Pr	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
1-109	i-Pr	H	2-NO ₂	H	2-Me		
1-110	i-Pr	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		

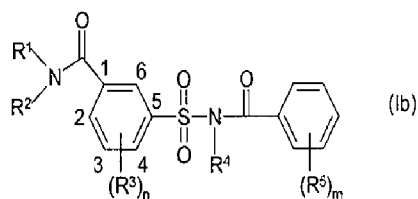
Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
1-111	i-Pr	H	2-NO ₂	H	2,5-(Me) ₂		
1-112	Me	H	-	H	2,3-(Me) ₂	88-92	227
1-113	Me	H	-	H	2,5- Cl ₂		
1-114	Me	H	-	H	2-Me		
1-115	Me	H	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-116	Me	H	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-117	Me	H	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	88-92	
1-118	Me	H	-	H	2-Cl		
1-119	Me	H	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-120	Me	H	-	Me	2,5-(Me) ₂		
1-121	Me	Et	-	H	2-Cl	88-92	188
1-122	Me	Et	-	H	2-OMe		
1-123	Me	Et	-	H	2-Me		
1-124	Me	Et	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	88-92	
1-125	Me	Et	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-126	Me	Et	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
1-127	Me	Et	-	Me	2,5-(Me) ₂		
1-128	Me	Me	-	H	2-OMe		
1-129	Me	Me	-	H	2-Me		
1-130	Me	Me	-	H	2-Cl		
1-131	Me	Me	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-132	Me	Me	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-133	Me	Me	-	H	2,3-(Me) ₂	88-92	205
1-134	Me	Alla	-	H	2-Cl		
1-135	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		-	H	2-OMe		
1-136	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		-	H	2-OMe, 5-Me		
1-137	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		-	H	2-Cl		
1-138	-(CH ₂) ₄ -		-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
1-139	-(CH ₂) ₅ -		-	H	2,5-(Me) ₂	88-92	157
1-140	-(CH ₂) ₅ -		-	H	2,5- Cl ₂		
1-141	-(CH ₂) ₅ -		-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-142	-(CH ₂) ₅ -		-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
1-143	-C ₂ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-	H	2-OMe, 5-Me		
1-144	-C ₂ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-145	-C ₂ H ₄ -C ₆ H ₅	H	-	H	2-OMe		
1-146	-(CH ₂) ₄ -		-	Me	2-OMe, 5-Cl		
1-147	Me	Et	-	Me	2-OMe		
1-148	Pr	Pr	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-149	Pr	Pr	-	H	2,5-(Me) ₂		
1-150	Et	H	-	H	2-OMe		

Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
1-151	Et	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-152	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-153	CH(CH ₃)-C ₃ H ₇	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-154	c-Pr	H	-	H	2-O-CH ₂ CH ₂ -3		
1-155	s-Bu	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-156	s-Bu	H	-	H	2-OMe		
1-157	2-heptila	H	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-158	2-heptila	H	-	H	2-OMe		
1-159	Me	Me	-	H	2-OMe, 5-Cl		
1-160	Me	Et	-	Me	2-Me		
1-161	c-Pr	H	2-NO ₂	H	2-OMe		
1-162	Pr	H	2-Cl	H	2-Me		
1-163	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe		

Tabela 2: Compostos da fórmula (Ib)



Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
2-1	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-2	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2-OMe		
2-3	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2-Cl		
2-4	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2-Me	86-90	
2-5	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2,3-(Me) ₂	85-89	
2-6	Pr	H	2,4- Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me	84-88	
2-7	Pr	H	2,4 Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl	84-88	
2-8	Pr	H	2,4- Cl ₂	Me	2-OMe, 5-Me	83-87	
2-9	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me		
2-10	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl	76-80	
2-11	Pr	H	H	H	2-OMe		
2-12	Pr	H	H	H	2,5-(Me) ₂	76-80	
2-13	Bu	H	2,4- Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-14	Bu	H	2,4- Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
2-15	Bu	H	2,4- Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
2-16	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Me		
2-17	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Cl		

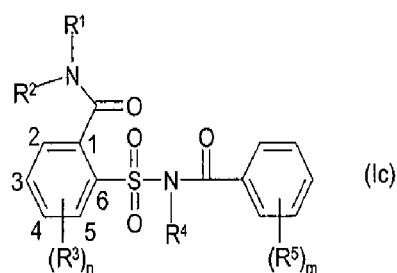
Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
2-18	Bu	H	H	H	2-OMe		
2-19	Bu	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
2-20	Me	H	4-Cl	H	2-Cl		
2-21	Me	H	4-Cl	H	2-Me		
2-22	Me	H	4-Cl	H	2,3-(Me) ₂	87-91	215
2-23	Me	Me	2,4- Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
2-24	Me	Me	2,4- Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
2-25	Me	Me	2,4- Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-26	Me	Me	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
2-27	Me	Me	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
2-28	Me	Me	4-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl	87-91	
2-29	Me	Me	4-Cl	Me	2-OMe, 5-Me		
2-30	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Me		
2-31	Me	Me	H	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-32	Me	Me	H	H	2-OMe		
2-33	C ₂ H ₄ -OMe	H	2,4- Cl ₂	H	2-OMe		
2-34	C ₂ H ₄ -OMe	H	2,4- Cl ₂	H	2-Me		
2-35	C ₂ H ₄ -OMe	H	2,4-Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-36	C ₂ H ₄ -OMe	H	2,4-Cl ₂	H	2-Cl		
2-37	C ₂ H ₄ -OMe	H	2,4-Cl ₂	H	2,5-Cl ₂		
2-38	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-39	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe	84-88	174
2-40	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-Cl		
2-41	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-Me		
2-42	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe		
2-43	c-Pr	H	4-Cl	H	2-Me		
2-44	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2,5-Cl ₂		
2-45	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2,3-(Me) ₂	83-87	
2-46	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
2-47	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
2-48	c-Pr	H	2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-49	c-Pr	H	4-Cl	H	2-Cl		
2-50	c-Pr	H	4-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
2-51	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me	83-87	
2-52	c-Pr	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
2-53	c-Pr	H	4-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-54	c-Pr	H	4-Cl	Me	2-OMe, 5-Me		
2-55	c-Pr	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
2-56	c-Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me	76-80	
2-57	c-Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl		

Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
2-58	c-Pr	H	H	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-59	alila	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe		
2-60	alila	H	2,4-Cl ₂	H	2-Cl		
2-61	CH ₂ C≡CH	H	2,4-Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-62	CH ₂ C≡CH	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
2-63	CH ₂ C≡CH	H	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
2-64	CH ₂ C≡CH	H	2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-65	CH ₂ C≡CH	H	2,4-Cl ₂	Me	2-OMe, 5-Me		
2-66	CH ₂ C≡CH	H	4-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
2-67	CH ₂ C≡CH	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
2-68	CH ₂ C≡CH	H	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
2-69	CH ₂ C≡CH	H	4-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-70	-(CH ₂) ₄ -		2,4-Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
2-71	-(CH ₂) ₄ -		2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
2-72	-(CH ₂) ₄ -		2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl		
2-73	-(CH ₂) ₄ -		2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
2-74	-(CH ₂) ₄ -		H	H	2-OMe, 5-Cl		
2-75	-(CH ₂) ₄ -		H	H	2-OMe		
2-76	Me	Et	H	H	2-OMe, 5-Cl		
2-77	Me	Et	H	H	2-OMe		
2-78	i-Pr	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
2-79	Me	H	H	H	2-OMe		
2-80	Me	H	H	H	2,5-(Me) ₂		

Tabela 3: Compostos da fórmula (Ic)



Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
3-1	Pr	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
3-2	Pr	H	H	H	2-OMe		
3-3	Pr	H	H	H	2-Cl		
3-4	Pr	H	H	H	2-Me		
3-5	Pr	H	H	H	2,3-(Me) ₂		

Continuação

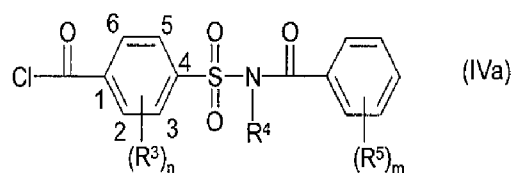
Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
3-6	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Me		
3-7	Pr	H	H	H	2-OMe, 5-Cl		
3-8	Pr	H	H	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
3-9	Pr	H	H	Me	2-OMe, 5-Me		
3-10	Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
3-11	Pr	H	2-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
3-12	Bu	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
3-13	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Me		
3-14	Bu	H	H	H	2-OMe, 5-Cl		
3-15	Bu	H	H	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
3-16	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
3-17	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
3-18	Bu	H	2-Cl	H	2-OMe		
3-19	Bu	H	2-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
3-20	Me	H	2-Cl	H	2-Cl		
3-21	Me	H	2-Cl	H	2-Me		
3-22	Me	H	2-Cl	H	2,3-(Me) ₂		
3-23	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Me		
3-24	Me	Me	H	H	2-OMe, 5-Cl		
3-25	Me	Me	H	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
3-26	Me	Me	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
3-27	Me	Me	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
3-28	Me	Me	2-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
3-29	Me	Me	2-Cl	Me	2-OMe, 5-Me		
3-30	Me	Me	4-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me		
3-31	Me	Me	4-NO ₂	H	2-OMe		
3-32	C ₂ H ₄ -OMe	H	H	H	2-OMe		
3-33	C ₂ H ₄ -OMe	H	H	H	2,5-Cl ₂		
3-34	c-Pr	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
3-35	c-Pr	H	H	H	2-OMe		
3-36	c-Pr	H	H	H	2-Cl		
3-37	c-Pr	H	H	H	2-Me		
3-38	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe		
3-39	c-Pr	H	2-Cl	H	2-Me		
3-40	c-Pr	H	2-Cl	H	2-Cl		
3-41	c-Pr	H	2-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
3-42	c-Pr	H	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me		
3-43	c-Pr	H	2-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
3-44	c-Pr	H	2-Cl	Me	2-OMe, 5-Me		
3-45	alila	H	H	H	2-OMe		

Continuação

Nº do Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
3-46	alila	H	H	H	2-Cl		
3-47	alila	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
3-48	alila	H	H	H	2,5-Cl ₂		
3-49	CH ₂ C≡CH	H	H	H	2,5-(Me) ₂		
3-50	CH ₂ C≡CH	H	H	H	2-OMe, 5-Me		

As Tabelas 4 até 6 listam alguns exemplos dos compostos da fórmula (IV) que são preparados:

Tabela 4: Compostos da fórmula (IVa)

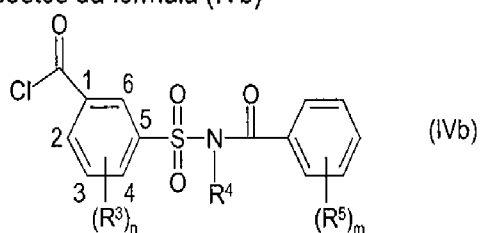


Nº do Composto	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
4-1	-	H	-	94-98	182
4-2	-	H	2,3-(Me) ₂	90-94	
4-3	-	H	2,4- Cl ₂	94-98	
4-4	-	H	2,5- Cl ₂	90-94	140
4-5	-	H	2,5-(Me) ₂	89-93	
4-6	-	H	2-Cl	93-97	198
4-7	-	H	2-Me	92-96	
4-8	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	90-94	178
4-10	-	H	2-OMe	92-96	126
4-11	-	H	2-OMe, 5-Cl	91-95	138-140
4-12	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	88-92	160-163
4-13	3-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	90-94	165
4-14	-	Me	2,3-(Me) ₂	93-97	
4-15	-	Me	2,5- (Me) ₂	88-92	
4-17	-	Me	2-Me	93-97	
4-18	-	Me	2-OMe	88-92	
4-19	-	Me	2-OMe, 5-Cl	93-97	
4-20	-	Me	2-OMe, 5-Me	88-92	
4-21	2-Cl	H	2-Me	93-97	
4-22	2-Cl	H	2-OMe	88-92	128
4-23	2-Cl	H	2-OMe-5-Cl	90-94	
4-24	2-NO ₂	H	2,3-(Me) ₂	93-97	

Continuação

Nº do Composto	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
4-25	2-NO ₂	H	2,5-(Me) ₂	93-97	
4-26	2-NO ₂	H	2-Cl	88-92	
4-27	2-NO ₂	H	2-Me	93-97	130
4-28	2-NO ₂	H	2-OMe	90-94	123
4-29	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Cl	88-92	112
4-30	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me	90-94	125
4-31	2-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me	88-92	139

Tabela 5: Compostos da fórmula (IVb)

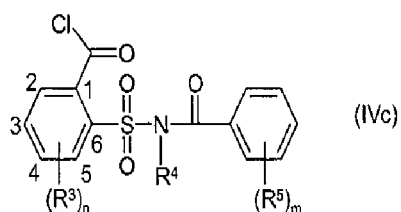


Nº do Composto	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
5-1	2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
5-2	2,4-Cl ₂	H	2,3-(Me) ₂	86-90	
5-3	2,4-Cl ₂	H	2,5-(Me) ₂		
5-4	2,4-Cl ₂	H	2-Cl	76-80	
5-6	2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
5-7	2,4-Cl ₂	H	2-OMe	87-91	
5-8	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl	82-86	
5-9	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me	77-81	
5-10	2,4-Cl ₂	Me	2-OMe, 5-Me		
5-11	2,4-Cl ₂	H	2,3-(Me) ₂	75-79	
5-15	2,4-Cl ₂	H	2-Me		
5-16	2,4-Cl ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
5-17	2,4-Cl ₂	H	2-OMe		
5-18	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Cl	82-86	
5-19	2,4-Cl ₂	H	2-OMe, 5-Me		
5-20	2,4-Cl ₂	Me	2-OMe, 5-Me		
5-21	4-Cl	H	2,3-(Me) ₂	82-86	
5-22	4-Cl	H	2,5-(Me) ₂		
5-23	4-Cl	H	2-Cl	74-78	
5-24	4-Cl	H	2-Me		
5-25	4-Cl	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
5-26	4-Cl	H	2-OMe	76-80	

Continuação

Nº do Composto	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
5-27	4-Cl	H	2-OMe, 5-Cl		
5-29	4-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	82-86	
5-31	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl		
5-32	-	H	2-OMe	81-85	
5-33	-	H	2-OMe, 5-Cl		
5-34	-	H	2-OMe, 5-Me	82-86	

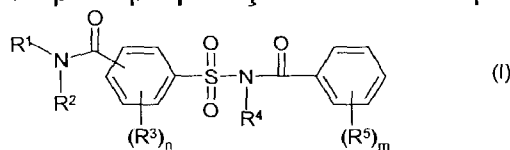
Tabela 6: Compostos da fórmula (IVc)



Nº do Composto	R ³	R ⁴	R ⁵	Rendimento %	Pf °C
6-1	2-Cl	H	2,3-(Me) ₂	81-85	180-185
6-2	2-Cl	H	2,5-(Me) ₂	93-97	102
6-3	2-Cl	H	2-Cl	92-96	110
6-4	2-Cl	H	2-Me	88-92	
6-6	2-Cl	H	2-OMe	93-97	118
6-7	2-Cl	H	2-OMe, 5-Cl	91-95	
6-8	2-Cl	H	2-OMe, 5-Me	87-91	
6-9	2-Cl	Me	2-OMe, 5-Me	87-91	98
6-10	4-NO ₂	H	2-NO ₂ , 4-Cl	89-93	
6-13	4-NO ₂	H	2-OMe, 5-Me	90-94	
6-16	-	H	2,5-Cl ₂	89-93	
6-17	-	H	2-Cl	92-96	
6-18	-	H	2-Me	91-95	
6-19	-	H	2-NO ₂ , 4-Cl	88-92	
6-20	-	H	2-OMe	88-92	
6-21	-	H	2-OMe, 5-Cl	88-92	
6-22	-	H	2-OMe, 5-Me	88-92	
6-23	-	Me	2-OMe, 5-Me	88-92	

REIVINDICAÇÕES

1. Processo para preparação de um composto da fórmula (I):



na qual:

R^1 é hidrogênio, $-(CH_2)_p$ -heterociclila ou um radical de hidrocarbônico, em que os dois radicais mencionados por último são não-substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, ciano e nitro;

R^2 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_2-C_6) -alquenila, (C_2-C_6) -alquinila, (C_1-C_6) -alcóxi, (C_2-C_6) -alquenilóxi, em que os cinco radicais mencionados por último são não-substituídos ou são substituídos por um ou mais radicais selecionados do grupo que consiste em halogênio, (C_1-C_4) -alcóxi e (C_1-C_4) -alquiltio; ou

R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ligante formam um anel saturado ou insaturado de 3 até 8 membros;

R^3 e R^5 são cada um independentemente halogênio, (C_1-C_6) -alquila, (C_1-C_6) -haloalquila, (C_1-C_6) -alcóxi, $S(O)_q$ -(C_1-C_6)-alquila, (C_1-C_6) -alquilcarbonila, -CO-arila, ciano ou nitro; ou dois grupos R^5 adjacentes formam a porção -O-CH₂CH₂-;

R^4 é hidrogênio, (C_1-C_4) -alquila, (C_2-C_4) -alquenila ou (C_2-C_4) -alquinila;

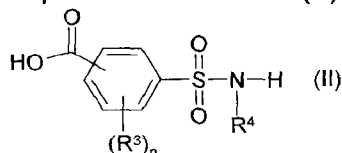
n é um número inteiro de 0 até 4;

m é um número inteiro de 0 até 5;

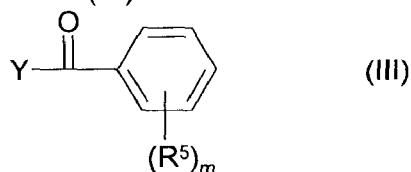
p é 0 ou 1; e

q é 0, 1 ou 2; ou um sal do mesmo;

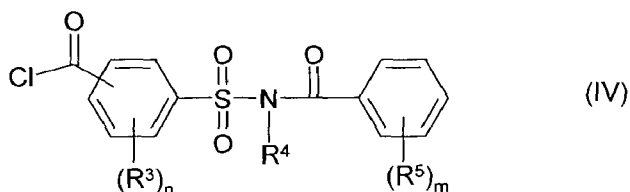
o referido processo sendo caracterizado pelo fato de que compreende a reação de um composto da fórmula (II):



na qual R^3 , R^4 e n são como definidos na fórmula (I),
com um composto da fórmula (III):



na qual R^5 e m são como definidos na fórmula (I) e Y é OH ou Cl,
na presença de um agente de cloração, para fornecer um composto da fórmula (IV):



na qual R^3 , R^4 , R^5 , m e n são como definidos na fórmula (I), seguidos pela reação do composto da fórmula (IV) resultante com um composto da fórmula (V):



na qual R^1 e R^2 são como definidos na fórmula (I),
na presença de uma base.

2. Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que o agente de cloração é o cloreto de tionila.

3. Processo de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que a quantidade de agente de cloração utilizada é, quando Y for OH de 1 até 2 equivalentes molares por equivalentes de (II) e de (IIIa) ou quando Y for Cl de 1 até 2 equivalentes molares por equivalente de (II).

4. Processo de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que o solvente utilizado na reação do composto da fórmula (II) com o composto da fórmula (III) é o clorobenzeno.

5. Processo de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que:

R^1 é hidrogênio, (C_1-C_6) -alquila ou (C_3-C_6) -cicloalquila;

R^2 e R^4 são cada um hidrogênio;

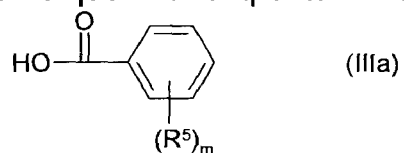
R^5 é (C_1-C_6) -alcóxi;

n é 0;

m é 0 ou 1;

e o grupo sulfamoíla fica localizado para a porção CONR^1R^2 no anel fenila.

6. Processo de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que um composto da fórmula (IIIa):

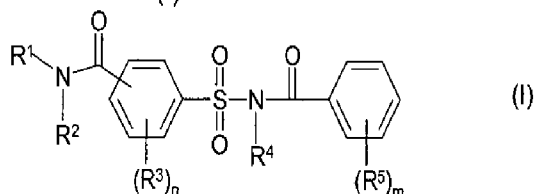


5 na qual R^5 e m são como definidos na reivindicação 1,
é utilizado como um composto da fórmula (III).

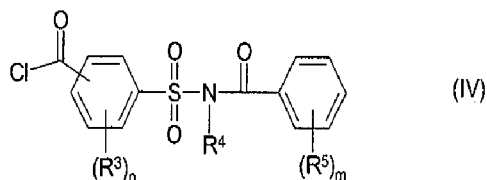
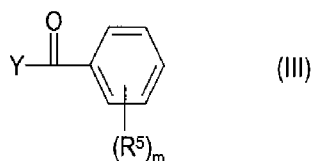
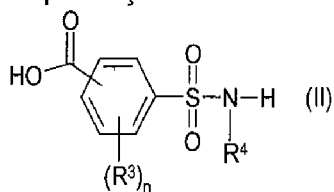
RESUMO

Patente de Invenção: "PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE ACIL-SULFAMOILBENZAMIDAS".

A presente invenção refere-se a um processo para a preparação
5 de um composto da fórmula (I):



que compreende a reação de um composto da fórmula (II) com um compos-
to da fórmula (III) na presença de um agente de cloração, seguida pela rea-
ção do composto resultante da fórmula (IV) com um composto da fórmula (V)
na presença de uma base:



em que os vários símbolos são como definidos na reivindicação 1.