



Patent dodatkowy
do patentu nr _____

Zgłoszono: 24.07.78 (P. 208616)

Pierwszeństwo: 25.07.77 Węgry

Zgłoszenie ogłoszono: 07.05.79

Opis patentowy opublikowano: 30.04.1982

Int. Cl.² C07D 207/44
C07D 207/40

Twórca wynalazku _____

Uprawniony z patentu: Chinoin Gyógyszer és Vegyészeti Termékek
Gyára Rt., Budapeszt (Węgry)

Sposób wytwarzania nowych pochodnych imidu kwasu maleinowego i imidu kwasu bursztynowego

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób wytwarzania nowych pochodnych imidu kwasu maleinowego i imidu kwasu bursztynowego stanowiących substancję czynną środka chwastobójczego.

Pochodne imidu kwasu maleinowego i imidu kwasu bursztynowego wytwarzane sposobem według wynalazku określone są odpowiednio wzorem 1 i wzorem 2, w których to wzorach R oznacza atom wodoru lub chlorowca, ewentualnie podstawioną grupę hydroksylową, ewentualnie podstawioną grupę merkaptu, grupę alkilową, cykloalkilową, aryloową, aryloalkilową lub podstawioną grupę sulfonylową, R₁ oznacza atom wodoru, grupę alkilową, aryloową, aryloalkilową, ewentualnie podstawioną grupę aminową, R₂ oznacza atom wodoru lub chlorowca, grupę alkilową, aryloową, aryloalkilową lub podstawioną grupę aminową, a R₃ oznacza atom wodoru, grupę alkilową, aryloową, aryloalkilową, alkoksylową lub aryloksylową.

Używane w definicji podstawnika R określenie podstawiona grupa hydroksylowa lub podstawiona grupa merkaptu oznacza grupę hydroksylową lub merkaptu podstawioną grupą alkilową, aryloową lub aryloalkilową.

Określenie grupa alkilowa oznacza grupę o łańcuchu prostym lub rozgałęzionym zawierającą 1—20 atomów węgla, korzystnie 1—6, a zwłaszcza 1—4 atomów węgla, taką jak grupa metylowa, etylowa n- i izopropylowa, n-, izo-, IIIrząd.- i IIIrząd.-butylowa, pentylowa lub heksylowa. Grupy cykloalki-

2

lowe mogą zawierać 4—8, korzystnie 5—7 atomów węgla.

Grupami aryłowymi mogą być grupy karbocykliczne zawierające w pierścieniu 6—10 atomów węgla, przy czym grupy te mogą być podstawione lub niepodstawione. Podstawnikami grup arylowych może być jedna lub kilka grup alkilowych lub alkoksylowych albo atomów chlorowca.

Grupy aryloalkilowe mogą zawierać grupę aryloową i alkilową określone powyżej.

Atomem chlorowca może być atom fluoru, chloru, bromu lub jodu, korzystnie atom chloru lub bromu.

Szczególnie korzystnymi związkami o wzorze 1 i o wzorze 2 są takie związki, w których we wzorach R oznacza atom wodoru lub chlorowca, korzystnie atom chloru, grupę fenyloową, grupę fenyloalkilotio zawierającą w części alkilowej 1—4 atomów węgla, grupę alkilotio zawierającą 1—6 atomów węgla, grupę cykloalkilotio zawierającą 5—7 atomów węgla, grupę fenylotio lub grupę fenylosulfonylową, R₁ oznacza atom wodoru, grupę aminową, grupę cykloalkiloaminową zawierającą 5—7 atomów węgla, grupę alkiloaminową zawierającą 1—6 atomów węgla, grupę alkoksylową podstawioną fenyloalkiloaminową zawierającą w każdej części alkoksylowej i alkilowej 1—4 atomów węgla, grupę fenyloaminową, naftyloaminową, furfuryloaminową, grupę fenyloalkiloaminową zawierającą w części alkilowej 1—4 atomów węgla lub grupę fenyloaminową podstawioną atomem chlorowca albo grupą

3

alkilową lub alkoksylową o 1—4 atomach węgla, R₂ oznacza atom wodoru, a R₃ oznacza grupę alkilową o 1—6 atomach węgla, alkoksylową lub fenylową.

Znane są N-acylowane pochodne niepodstawionych imidów kwasu bursztynowego i maleinowego o podobnej budowie, na przykład imid kwasu N-karboetoksybursztynowego, który otrzymywano z soli potasowej imidu kwasu bursztynowego i chloromrówczanu etylu (Ber. 54, 1114 (1921)). Imid kwasu N-acetylobursztynowego otrzymywano z imidu kwasu bursztynowego przez gotowanie go z bezwodnikiem kwasu octowego (Ber. 33, 2225 (19)).

Imid kwasu N-benzoilobursztynowego otrzymywano przez gotowanie w pirydynie roztworu imidu kwasu bursztynowego z chlorkiem benzoilu (J. Chem. Soc. 85, 1685), natomiast imid kwasu N-acetylmaleinowego otrzymywano przez utlenianie trójtlenkiem chromu N-acetylopirołu (Zur. Obszcz. Chim. 19, 2118—2122 (1949)).

Wytwarzanie pochodnych imidu kwasu maleinowego o budowie najbardziej zbliżonej do związków otrzymywanych sposobem według wynalazku opisano w C.A. 72, 43221 b. Sposób ten polega na acylowaniu 3-chloro-4-arylo-podstawionych imidów kwasu bursztynowego bezwodnikiem kwasu octowego w atmosferze azotu i w temperaturze wrzenia, przy czym odszczepia się chlorowodór, dodając odpowiedni imid kwasu 3-arylo-4-acetylmaleinowego.

Sposób wytwarzania nowych pochodnych imidu kwasu maleinowego i imidu kwasu bursztynowego odpowiednio o wzorze 1 i o wzorze 2 według wynalazku polega na tym, że w przypadku wytwarzania związku o wzorze 1 związek o wzorze 3, w którym R₄ oznacza atom wodoru lub atom metalu alkalicznego, poddaje się reakcji ze związkiem o wzorze R₃-COX, w którym X oznacza atom chlorowca, lub związek o wzorze 3, w którym R₄ ma wyżej podane znaczenie, poddaje się reakcji ze związkiem o wzorze (R₃CO)₂O, natomiast w przypadku wytwarzania związku o wzorze 2, związek o wzorze 4, w którym R₄ ma wyżej podane znaczenie poddaje się reakcji ze związkiem o wzorze R₃-COX, w którym X ma wyżej podane znaczenie, lub związek o wzorze 4, w którym R₄ ma wyżej podane znaczenie, poddaje się reakcji ze związkiem o wzorze (R₃CO)₂O. Podstawniki R, R₁, R₂ i R₃ we wzorach 1, 2, 3 i 4 oraz we wzorze R₃-COX mają wyżej podane znaczenie. Korzystnie stosuje się środki acylujące bezwodnik kwasu octowego i odpowiednie estry kwasu chloromrówkowego.

Reakcje te prowadzi się albo w obecności rozpuszczalnika, korzystnie acetonu, albo bez rozpuszczalnika dodając środki wiążące kwas, korzystnie trójetyloaminę, albo nie stosując tych środków.

Związki o wzorze 1 oraz o wzorze 2 otrzymane sposobem według wynalazku wykazują cenną czynność chwastobójczą i dlatego mogą być stosowane jako substancje czynne środka do użytku w rolnictwie.

Związki o wzorze 1 lub o wzorze 2 wytwarza się korzystnie przez rozpuszczenie lub sporządzenie zawiesiny podstawionych imidów kwasu maleinowego lub bursztynowego, odpowiednio o wzorze 3 lub

4

o wzorze 4, posiadających atom wodoru połączony z atomem azotu, w obojętnym rozpuszczalniku, takim jak aceton, benzen, toluen lub dioksan, i przez poddanie otrzymanej mieszaniny reakcji z 1 lub 1,5 równoważnika środka acylującego. Reakcję prowadzi się w temperaturze pokojowej lub w temperaturze wrzenia mieszaniny reakcyjnej i/albo dodaje się trójetyloaminę lub inny środek wiążący kwas w ilości równoważnej w stosunku do użytej ilości środka acylującego albo nie dodaje się środka wiążącego kwas.

Podczas prowadzenia reakcji acylowania w acetonie jest szczególnie korzystne dodanie środka acylującego jednocześnie ze środkiem wiążącym kwas, w temperaturze 25°C. Reagenty miesza się 1 godzinę w temperaturze pokojowej i dalsze 10—30 minut w temperaturze wrzenia.

Mieszaninę przerabia się dalej zgodnie z właściwościami acylowanego produktu.

Jeżeli acylowany związek o wzorze 1 lub o wzorze 2 wytrąca się z mieszaniny reakcyjnej, to surowy produkt oddziela się przez odsączenie i przemycie osadu wodą, a produkt końcowy otrzymuje się przez krystalizację osadu.

Jeżeli acylowany związek o wzorze 1 lub o wzorze 2 nie wytrąca się z mieszaniny reakcyjnej, to wytrącony produkt uboczny, odsącza się, ewentualnie po uprzednim odparowaniu mieszaniny reakcyjnej, a następnie surowy produkt otrzymuje się po odparowaniu rozpuszczalnika. Produkt czysty otrzymuje się z surowego produktu przez krystalizację, taką jak wspomniana poprzednio.

Otrzymane związki o wzorze 1 i o wzorze 2 wykazują czynność chwastobójczą, a poza tym, już bez żadnej dalszej przeróbki wymaganej w przypadku stosowania ich w preparatach chwastobójczych, mogą być używane jako półprodukty do syntez.

Zaletą sposobu według wynalazku jest jego prostota i możliwość bezpośredniego wytwarzania związków o wzorze 1 i o wzorze 2, charakteryzujących się dużą czystością i dzięki temu przydatnością do dalszego użytku.

Związki o wzorze 3 i o wzorze 4 stosowane jako związki wyjściowe w opisanych reakcjach otrzymuje się metodami znanymi per se. W celu otrzymania 3-podstawionych amino-pochodnych imid kwasu 3-bromomaleinowego poddaje się reakcji z odpowiednimi aminami (Ber. 21, 2718 (1888), Gazz. Chim. Ital. 65, 1221 (1935)). Imidy 3,4-dwupodstawionego kwasu maleinowego otrzymuje się według Tetraedron 24, 4051 (1968), J. Org. Chem. 26, 2032, (1961), J. Amer. Soc. Chem. 80, 1385 (1958), a imidy 3-podstawionego kwasu bursztynowego otrzymuje się według J. Org. Chem. 26, 787 (1961).

Aktywność chwastobójczą związków o wzorze 1 i o wzorze 2 otrzymanych sposobem według wynalazku wykonano posługując się następującymi testami.

Badanie kiełkowania

Zdolność hamowania kiełkowania badano na gorczycy jasnej (*Sinapis alba*) i włośnicy (*Setaria sp.*). Związki stosowano w dawce 10 mg na płytkę Petriego i kiełkowanie obserwowano w ciągu 1 tygodnia, trzymając rośliny w ciemności. Zdolność ha-

mowania określano w procentach w odniesieniu do roślin kontrolnych. Wyniki zestawiono w tablicy 3.

Traktowanie przed wzejściem

Nasiona gorczyicy jasnej i włośnicy wysiano na płytkach hodowlanych i po wysianiu zastosowano na glebę znajdującą się na płytkach dawkę 20 kg/ha badanego związku, a następnie płytki umieszczono w cieplarni na okres 1 tygodnia. Aktywność chwastobójczą oceniano po tygodniu i wyrażano w procentach w odniesieniu do roślin kontrolnych. Wyniki zestawiono w tablicy 3.

Traktowanie po wzejściu

Liście tygodniowych siewek gorczyicy jasnej i włośnicy spryskano cieczą zawierającą badany związek w ilości odpowiadającej dawce 20 kg/ha. Aktywność chwastobójczą oceniono po tygodniu i wyrażano w procentach w odniesieniu do roślin kontrolnych. Wyniki zestawiono w tabeli 3.

Tabela 3

Numer kodowy badanej substancji czynnej	Hamowanie kiełkowania		Aktywność przed wzejściem, %		Aktywność po wzejściu, %	
	Se-taria	Si-napis	Se-taria	Si-napis	Se-taria	Si-napis
971	82	75	—	—	90	45
1144	41	76	10	10	10	45
1223	97	90	18	20	0	30
1225	80	80	18	12	0	45
1227	40	70	20	18	10	20
1243	95	95	—	—	60	65
1271	10	10	—	—	—	—
1272	10	15	—	—	—	—
1473	—	—	—	—	0	0
1524	0	0	18	20	0	0
1527	10	12	12	16	0	0
1528	0	0	20	15	0	0
1532	0	0	—	—	0	0
1539	10	15	—	—	0	0
1541	0	0	—	—	0	0
1542	16	13	—	—	0	0
1622	0	0	—	—	0	0
1662	0	0	—	—	0	0
1667	15	20	—	—	0	0
1668	0	0	—	—	0	0
1670	0	0	—	—	0	0
1673	0	0	—	—	0	0

Numery kodowe z tablicy 3 odpowiadają następującym związkom

- 971 imid kwasu 3-feniloamino-N-karboetoksymaleinowego
 1144 imid kwasu 3-cykloheksyloamino-N-karboetoksymaleinowego
 1223 imid kwasu 3-feniloamino-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1225 imid kwasu 3-(4-metylofeniloamino)-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1227 imid kwasu 3-(4-metoksyfeniloamino)-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1243 imid kwasu 3-amino-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1271 imid kwasu 3-(4-chlorofeniloamino)-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1272 imid kwasu 3-(3,5-dwuchlorofeniloamino)-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego

- 1473 imid kwasu 3-fenilosulfonylo-N-karboetoksymaleinowego
 1524 imid kwasu 3-n-butyloamino-N-karboetoksymaleinowego
 1527 imid kwasu 3-feniloamino-N-karboetoksybursztynowego
 1528 imid kwasu 3-(3,4-dwumetoksyfeniloetyloamino)-N-karboetoksymaleinowego
 1532 imid kwasu 3-(β-naftyloamino)-4-chloro-N-karboetoksymaleinowego
 1539 imid kwasu 3-(4-metylofeniloamino)-N-karboetoksybursztynowego
 1541 imid kwasu 3-(4-chlorofeniloamino)-N-karboetoksybursztynowego
 1542 imid kwasu 3-n-heksyloamino-N-karboetoksymaleinowego
 1622 imid kwasu 3-feniloamino-4-fenylotio-N-karboetoksymaleinowego
 1662 imid kwasu 3-feniloamino-4-fenilosulfonylo-N-karboetoksymaleinowego
 1667 imid kwasu 3-feniloamino-4-izobutyliotio-N-karboetoksymaleinowego
 1668 imid kwasu 3-feniloamino-4-izobutyliotio-N-karboetoksymaleinowego
 1670 imid kwasu 3-feniloamino-4-benzylotio-N-karboetoksymaleinowego
 1673 imid kwasu 3-feniloamino-4-cykloheksyloamino-N-karboetoksymaleinowego.

W następujących przykładach zilustrowano dokładniej sposób według wynalazku.

Przykład I. W 280 ml acetonu rozpuszczono mieszając 7,52 g (0,04 mola) imidu kwasu 3-feniloaminomaleinowego, a następnie do mieszanego roztworu dodano kroplami jednocześnie 6,48 g (0,06 mola) chloromrówczanu etylu i 6,06 g (0,06 mola) trójetyloaminy. Podczas dodawania temperaturę mieszaniny utrzymywano w zakresie 25–30°C. Całość mieszaniny 1,5 godziny w temperaturze pokojowej i ogrzewano do wrzenia pod chłodnicą zwrotną 10 minut, a następnie pozostawiono na noc. Wytrącony chlorowodorek trójetyloaminy odsączono, a przesącz zawierający aceton odparowano do suchej pozostałości. Otrzymaną żółtą substancję krystaliczną przemyto dwiema porcjami po 15 ml i odsączono. Po wysuszeniu surowy imid kwasu 3-feniloamino-N-karboetoksymaleinowego można w razie potrzeby przekrystalizować z octanu etylu lub absolutnego alkoholu.

Wydajność: 7,6 g (73%), temperatura topnienia 168–172°C.

Przykład II. W 70 ml acetonu rozpuszczono 1,88 g (0,01 mola) imidu kwasu 3-feniloaminomaleinowego i do roztworu dodano kroplami, podczas mieszania 1,17 g (0,015 mola) chlorku acetylu i 1,51 g (0,015 mola) trójetyloaminy. Podczas dodawania temperaturę mieszaniny utrzymywano w zakresie 25–35°C. Całość mieszaniny 2,5 godziny w temperaturze pokojowej i ogrzewano 1,5 godziny, a następnie pozostawiono na noc. Produkt wytrącił się razem z chlorowodorkiem trójetyloaminy. Mieszaninę kryształów odsączono i przemyto dwiema porcjami po 5 ml wody. Żółtą substancję krystaliczną poddano po wysuszeniu ponownej krystalizacji z acetonu lub dioksanu. Otrzymano imid kwasu 3-feniloamino-N-acetylomaleinowego.

Wydajność: 0,85 g (36,9%), temperatura topnienia 217–219°C.

Przykład III. W 60 ml bezwodnika kwasu octowego rozpuszczono w czasie ogrzewania 3,76 g (0,02 mola) imidu kwasu 3-feniloaminomaleinowego

7

i roztwór ogrzewano 5 godzin do temperatury wrzenia pod chłodnicą zwrotną, a następnie pozostawiono na noc. Wytrącone blade żółte kryształy odsączono i przemyto trzema porcjami po 10 ml wody. Otrzymany imid kwasu 3-fenylamino-N-acetyloamaleinowego można w razie potrzeby po wysuszeniu przekrystalizować z acetonu lub dioksanu.

Wydajność: 4 g (86%), temperatura topnienia 218—219°C.

Przykład IV. W 70 ml acetonu rozpuszczono mieszając 1,88 g (0,01 mola) imidu kwasu 3-fenylaminoamaleinowego i do roztworu dodano kroplami podczas równoczesnego mieszania 2,1 g (0,015 mola) chlorku benzoilu i 1,51 g (0,015 mola) trójetyloaminy. Podczas dodawania temperaturę mieszaniny utrzymywano w zakresie 25—30°C. Całość mieszaniny 2,5 godziny w temperaturze pokojowej i ogrzewano 1,5 godziny, a następnie pozostawiono na noc. Mieszaninę kryształów odsączono i przemyto dwiema porcjami po 10 ml wody. Po wysuszeniu otrzymano żółty, krystaliczny produkt, który w razie potrzeby można przekrystalizować z chloroformu lub acetonu. Otrzymano imid kwasu 3-fenylamino-N-benzoylamaleinowego.

Wydajność: 1,24 g (42,4%), temperatura topnienia 238—241°C.

Przykład V. W 60 ml acetonu rozpuszczono mieszając 4,44 g (0,15 mola) imidu kwasu 3-fenylamino-4-fenylotiomaleinowego i do roztworu ochłodzonego wodą z lodem dodano podczas mieszania mieszaninę 1,95 ml (0,025 mola) chloromrówczanu etylu i 2,25 ml (0,016 mola) trójetyloaminy, a następnie całość mieszaninę w ciągu dalszych 3 godzin,

8

chłodząc wodą z lodem. Wytrącony chlorowodorek trójetyloaminy odsączono, a roztwór macierzysty zawierający aceton odparowano do suchej pozostałości. Otrzymane pomarańczowe kryształy przemyto trzema porcjami po 5 ml eteru naftowego. Po wysuszeniu otrzymany imid kwasu 3-fenylamino-4-fenylotio-N-karbometoksymaleinowego poddano ewentualnie krystalizacji z metanolu.

Wydajność: 4,55 g (85%), temperatura topnienia 156—157°C.

Przykład VI. W 100 ml acetonu rozpuszczono mieszając 18,9 g (0,1 mola) imidu kwasu 3-fenyl-3-metylobursztynowego i do roztworu dodano kroplami podczas mieszania 16,2 g (0,15 mola) chloromrówczanu etylu i 15,1 g (0,15 mola) trójetyloaminy. Podczas dodawania temperaturę mieszaniny utrzymywano w zakresie 25—30°C. Całość mieszaniny w temperaturze pokojowej i 10 minut ogrzewano do temperatury wrzenia pod chłodnicą zwrotną. Mieszaninę pozostawiono na noc i odsączono wytrąconą trójetyloaminą. Roztwór macierzysty zawierający aceton odparowano do suchej pozostałości. Pozostały olej wykryształizował po ochłodzeniu. Otrzymano niemal białą substancję krystaliczną, którą przemyto wodą i odsączono. Po wysuszeniu otrzymany imid kwasu 3-fenyl-3-metylo-N-karboetoksybursztynowego poddano ewentualnie krystalizacji z 96% alkoholu.

Wydajność: 13,75 g (52%), temperatura topnienia 32—34°C.

W tabeli 1 zestawiono związki o wzorze 5 otrzymane według przykładu I z odpowiednich podstawionych imidów kwasu maleinowego o wzorze 3.

Tabela 1

Numer przykładowy	R	R ₁	Wydajność %	Temperatura topnienia °C
1	2	3	4	5
VII	wodór	4-metylofenylamino-	85,7	186—89
VIII	wodór	4-metoksyfenylamino-	70	166—69
IX	wodór	4-chlorofenylamino-	63	230—248
X	wodór	4-bromofenylamino-	78	240—45
XI	wodór	benzoylamino	68,4	86—90
XII	wodór	2-(3,4-dwumetoksyfenyl)- -etyloamino	68,9	108—112
XIII	wodór	n-butyloamino-	90	77—80
XIV	wodór	cykloheksyloamino-	92	92—96
XV	chlor	amino-	80	174—80
XVI	chlor	fenylamino-	84	120—26
XVII	chlor	4-metylofenylamino-	81	135—40
XVIII	chlor	4-metoksyfenylamino-	84,3	158—163
XIX	chlor	4-chlorofenylamino-	76,8	190—99
XX	chlor	3-chlorofenylamino-	53,8	150—161
XXI	chlor	3,5-dwuchlorofenylamino-	89	200—207
XXII	chlor	4-bromofenylamino-	87	190—98
XXIII	chlor	2-naftyloamino-	74	170—75
XXIV	fenylo-	fenylamino-	83	132—34
XXV	fenylotio-	fenylamino-	85,6	133—35
XXVI	fenylo- sulfonylo-	fenylamino-	72,5	205—206

1	2	3	4	5
XXVII	wodór	n-heksyloamino-	67	56—59
XXVIII	chlor	2-metylofenyloamino-	85	116—19
XXIX	fenylo-	benzyloamino-	73	109—111
XXX	fenylo-	n-heksyloamino-	80	46—47
XXXI	fenylo-	oktyloamino-	81	68—70
XXXII	fenylo-	cykloheksyloamino-	84	87—89
XXXIII	fenylo-	n-butyloamino-	83	63—64
XXXIV	wodór	furfuryloamino-	95	79—83
XXXV	cyklo-	fenyloamino-	88	114—16
	heksylo-	fenyloamino-		
XXXVI	benzylo-	fenyloamino-	89	107—108
XXXVII	izobutylo-	fenyloamino-	89	86—88
XXXVIII	etylo-	fenyloamino-	90	70—71
XXXIX	4-metylofenylo-	fenyloamino-	58	182—84
	sulfonylo-	fenyloamino-		

Następujące związki otrzymano również według przykładu I.

XL imid kwasu 3-fenyloamino-4-(izo-butylo)-
-N-karbometoksymaleinowego, 113—115°C

XLI imid kwasu 3-fenyloamino-4-etylo-N-kar-
bometoksymaleinowego, 83—86°C

XLII imid kwasu 3-fenyloamino-4-benzylo-N-
-karbometoksymaleinowego, 150—151°C

XLIII imid kwasu 3-fenyloamino-4-cykloheksylo-
-N-karbometoksymaleinowego, 131—134°C

XLIV imid kwasu 3-fenyloamino-4-chloro-N-kar-
bometoksymaleinowego, 155—157°C.

W tabeli 2 zestawiono związki o wzorze 6 otrzy-
mane według przykładu VI z podstawionych imi-
dów kwasu bursztynowego o wzorze 4.

Tabela 2

Numer przy- kładu	R	Wydaj- ność %	Tempe- ratura °C
XLV	fenyloamino-	67	102—105
XLVI	4-metylofenylo- amino-	58,8	94—99
XLVII	4-chlorofenylo- amino-	89	130—33

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania nowych pochodnych imi-
du kwasu maleinowego o wzorze 1, w którym R oz-
nacza atom wodoru lub chlorowca, ewentualnie pod-
stawioną grupę hydroksylową, ewentualnie podsta-
wioną grupę merkaptto, grupę alkilową, cykloalkilo-
wą, arylową, aryloalkilową lub podstawioną grupę
sulfonylową, R₁ oznacza atom wodoru, grupę alki-
lową, arylową, aryloalkilową, ewentualnie podsta-
wioną grupę aminową, grupa R₂ oznacza atom wo-
doru lub chlorowca, grupę alkilową, arylową, ary-
loalkilową lub podstawioną grupę aminową, a R₃
oznacza atom wodoru, grupę alkilową, arylową,
aryloalkilową, alkoksylową lub aryloksylową, zna-
mienny tym, że związek o wzorze 3, w którym R

i R₁ mają wyżej podane znaczenie, a R₄ oznacza atom
wodoru lub atom metalu alkalicznego, poddaje się
reakcji ze związkiem o wzorze R₃-COX lub
(R₃CO)₂O, w których R₃ ma wyżej podane znacze-
nie, a X oznacza atom chlorowca ewentualnie w
obecności rozpuszczalników i/lub środków wiążą-
cych kwas.

2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że
stosuje się nadmiar związku o wzorze (R₃CO)₂O, w
którym R₃ ma znaczenie podane w zastrz. 1.

3. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że
reakcje prowadzi się w obecności acetonu.

4. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że
jako związki acylujące o wzorze R₃-COX, w którym
R₃ oznacza grupę alkoksylową lub aryloksylową a
X atom chlorowca, stosuje się odpowiednie estry
kwasu chloromrówkowego.

5. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że
jako związek acylujący o wzorze (R₃CO)₂O, w któ-
rym R₃ oznacza grupę metylową stosuje się bezwod-
nik kwasu octowego.

6. Sposób wytwarzania nowych pochodnych imi-
du kwasu bursztynowego o wzorze 2, w którym R
oznacza atom wodoru lub chlorowca, ewentualnie
podstawioną grupę hydroksylową, ewentualnie pod-
stawioną grupę merkaptto, grupę alkilową, cykloalki-
lową, arylową, aryloalkilową lub podstawioną
grupę sulfonylową, R₁ oznacza atom wodoru, gru-
pę alkilową, arylową, aryloalkilową, ewentualnie
podstawioną grupę aminową, R₂ oznacza atom wo-
doru lub chlorowca, grupę alkilową, arylową, ary-
loalkilową lub podstawioną grupę aminową, a R₃
oznacza atom wodoru, grupę alkilową, arylową, ary-
loalkilową, alkoksylową lub aryloksylową, **znamienny**
tym, że związek o wzorze 4, w którym R, R₁ i R₂
mają wyżej podane znaczenie, a R₄ oznacza atom
wodoru lub atom metalu alkalicznego, poddaje się
reakcji ze związkiem o wzorze R₃-COX lub
(R₃CO)₂O, w którym R₃ ma wyżej podane znacze-
nie, a X oznacza atom chlorowca, ewentualnie w
obecności rozpuszczalników i/lub środków wiążących
kwas.

7. Sposób według zastrz. 6, **znamienny tym**, że sto-
suje się nadmiar związku o wzorze (R₃CO)₂O, w
którym R₃ ma znaczenie podane w zastrz. 6.

11

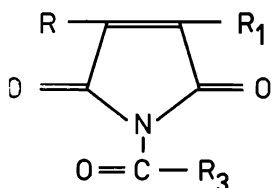
8. Sposób według zastrz. 6, **znamienny tym**, że reakcje prowadzi się w obecności acetonu.

9. Sposób według zastrz. 6, **znamienny tym**, że jako związki acylujące o wzorze $R_3\text{-COX}$, w którym R_3 oznacza grupę alkoksyłową lub aryloksyłową a X

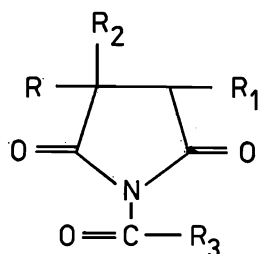
12

atom chlorowca, stosuje się odpowiednie estry kwasu chloromrówkowego.

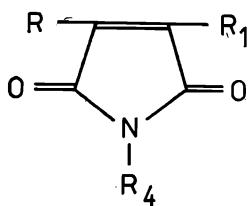
10. Sposób według zastrz. 6, **znamienny tym**, że jako związek acylujący o wzorze $(R_3\text{CO})_2\text{O}$ w którym R_3 oznacza grupę metylową, stosuje się bezwodnik kwasu octowego.



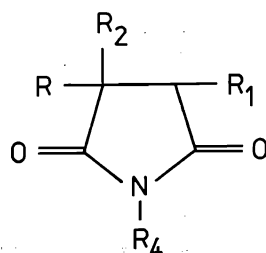
WZÓR 1



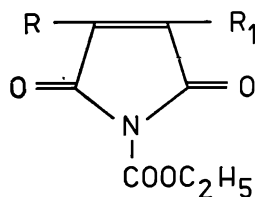
WZÓR 2



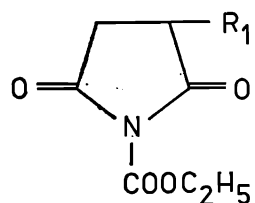
WZÓR 3



WZÓR 4



WZÓR 5



WZÓR 6