СОЮЗ СОВЕТСКИХ СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ РЕСПУБЛИК

(19) SU (11) 1282814 A3

(51) 4 C 07 D 207/404, 207/448

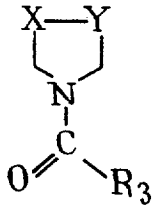
ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ СССР ПО ДЕЛАМ ИЗОБРЕТЕНИЙ И ОТКРЫТИЙ

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

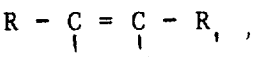
К ПАТЕНТУ

(21) 2640407/23-04
(22) 24.07.78
(31) C1-1757
(32) 25.07.77
(33) HU
(46) 07.01.87. Бюл. № 1
(71) Хиноин Дьедьсер еш Ведьесети Термекек Дьяра РТ (HU)
(72) Ене Шереш, Иштванне Дароци, Яношне Варконьи, Габор Хорват, Илдико Силадьи и Белани Радвани (HU)
(53) 547.298.1.07(088.8)
(56) Патент США № 3882145, кл. C 07 D 239/22, опублик. 1962.

(54)(57) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ МАЛЕИНИМИДА И СУКЦИНИМИДА общей формулы



где X - Y представляет собой группу

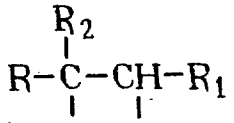


где R_1 - фениламиногруппа, которая может быть замещена алкилом C_1-C_8, метоксилом C_1-C_4, одним или двумя атомами галоида, циклогексиламиногруппа, бензиламиногруппа, фурфуриламиногруппа, нафтиламиногруппа, аминогруппа;

R - водород, хлор, фенил, который может быть замещен метилом; фенилтио, фенилсульфонил, циклогексилтио, бензилтио, алкилтио C_1-C_4, сульфонил;

R_3 - алкоксил C_1-C_4, бензокси

или X - Y представляет собой группу

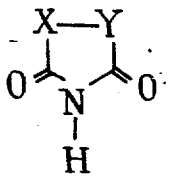


где R - фенил, водород;

R_1 - водород, фениламиногруппа, которая может быть замещена метилом или хлором;

R_2 - алкил C_1-C_4, водород,

отличающийся тем, что соединение общей формулы



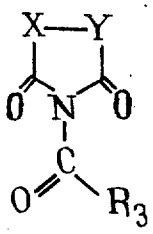
где X - Y имеет указанное значение, подвергают взаимодействию с ацилирующим агентом общей формулы

$$R_3 - CO - Cl,$$

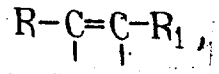
где R_3 имеет указанное значение.

SU (11) 1282814 A3

Изобретение относится к способам получения новых производных малеинимида и сукцинимида общей формулы



где X - Y представляет собой группу

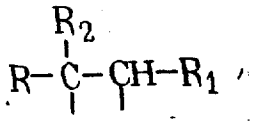


где R_1 - фениламиногруппа, которая может быть замещена алкилом C_1-C_8, метоксилом C_1-C_4, одним или двумя атомами галоида, циклогексиламиногруппа, бензиламиногруппа, фурфуриламиногруппа, нафтиламиногруппа, аминогруппа;

R - водород, хлор, фенил, который может быть замещен метилом, фенилтио, фенилсульфонил, циклогексилтио, алкилтио C_1-C_4;

R_3 - алкоксил C_1-C_4, бензокси

или X - Y представляет собой группу



где R - фенил, водород;

R_1 - водород, фениламиногруппа, которая может быть замещена метилом или хлором;

R_2 - алкил C_1-C_4, водород.

Соединения общей формулы (1) обладают гербицидной активностью, а также могут быть использованы в качестве промежуточных продуктов для синтеза новых производных урацил- и дигидроурацилкарбоновой кислоты, проявляющих ценные фармакологические свойства.

Целью изобретения является разработка способа получения новых биологически активных препаратов, расширяющих область воздействия на живой организм.

Пример 1. 7,52 г (0,04 моль) 3-фениламино-малеинимида растворяют при перемешивании в 280 мл ацетона. К этой смеси прикапывают одновременно 6,48 г (0,06 моль) этилового эфира хлормуравьиной кислоты и 6,06 г (0,06 моль) триэтиламина при перемешивании. В ходе добавления температуру смеси поддерживают на уровне 25-30°С. После добавления смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 1,5 ч и кипятят в течение 10 мин с обратным холодильником. Смесь оставляют на ночь и осажденный гидрохлорид триэтиламина фильтруют. Ацетонсодержащий маточный раствор концентрируют. Осажденное желтое кристаллическое вещество при желании промывают двухкратно водой с использованием каждый раз 15 мл воды и фильтруют.

После сушки полученный 3-фенил-амино-N-карбэтокси-малеинимид перекристаллизовывают из этилацетата или абсолютного спирта. Выход 7,6 г (73%), т. пл. 168-172°С.

Пример 2. 1,88 г (0,01 моль) 3-фениламино-малеинимида растворяют при перемешивании в 70 мл ацетона. К этому раствору прикапывают одновременно 1,17 г (0,015 моль) ацетилхлорида и 1,51 г (0,015 моль) триэтиламина при перемешивании. Температуру смеси во время добавления поддерживают на уровне 25-35°С. После этого смесь перемешивают в течение 2,5 ч при комнатной температуре, кипятят в течение 1,5 ч и оставляют на ночь при комнатной температуре. Продукт осаждают вместе с трихлорэтил-гидрохлоридом. Кристаллическую смесь фильтруют и промывают двухкратно водой с использованием каждый раз по 5 мл воды.

После сушки получают желтый продукт, который перекристаллизовывают из ацетона и диоксана, 3-фениламино-N-ацетил-малеинимид. Выход 0,85 г (36,9%), т. пл. 217-219°С.

Пример 3. 3,876 г (0,02 моль) 3-фениламино-малеинимида растворяют в 60 мл уксусного ангидрида при нагревании. Раствор нагревают в течение 5 ч с обратным холодильником и оставляют на ночь. Выпавшие в осадок желтые кристаллы фильтруют и промывают трехкратно водой с использованием каждый раз по 10 мл воды. Продукт при желании перекристаллизовывают из ацетона или диоксана.

Получают 3-фениламино-N-ацетил-малеинимид. Выход 4 г (86 %), т. пл. 218-219°С.

Пример 4. 1,88 г (0,01 моль) 3-фениламино-малеинимида растворяют при перемешивании в 70 мл ацетона. К этой смеси прикапывают одновременно 2,1 г (0,015 моль) бензоилхлорида и 1,51 г (0,015 моль) триэтиламина при перемешивании. В ходе добавления температуру поддерживают на уровне 25-30°С. После добавления смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 2,5 ч и кипятят в течение 1,5 ч. Смесь оставляют на ночь. Продукт осаждают вместе с гидрохлоридом триэтиламина. Кристаллическую смесь фильтруют, дважды промывают водой с использованием каждый раз по 10 мл воды.

После сушки полученный 3-фениламино-N-бензоил-малеинимид при желании перекристаллизовывают из хлороформа или ацетона. Выход 1,24 г (42,4%), т. пл. 238-241°С.

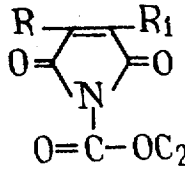
Пример 5. 4,44 г (0,015 моль) 3-фениламино-4-фенилтио-малеинимид растворяют при перемешивании в 60 мл ацетона. К охлажденной ледяной водой смеси прикапывают одновременно при перемешивании 1,95 мл (0,025 моль) метилового эфира хлормуравьиной кислота и 2,25 мл (0,016 моль) триэтиламина. После добавления перемешивают еще в течение 3 ч при охлаждении ледяной водой. Выпавший в осадок гидрохлорид триэтиламина фильтруют. Маточный раствор, содержащий ацетон, концентрируют. Полученные таким образом оранжевые кристаллы промывают петролейным эфиром.

После сушки полученный 3-фениламино-4-фенилтио-N-карбметокси-малеинимид при желании перекристаллизовывают из метанола. Выход 4,55 г (85%), т. пл. 156-157°С.

Пример 6. 18,9 г (0,1 моль) 3-фенил-3-метил-сукцинимида при перемешивании растворяют в 100 мл ацетона. Одновременно к раствору при перемешивании прикапывают 16,2 г (0,015 моль) метилового эфира хлормуравьиной кислоты и 15,1 г (0,15 моль) триэтиламина. В ходе добавления температуру поддерживают на уровне 25-30°С. После этого смесь перемешивают в течение 2 ч при комнатной температуре и нагревают в течение 10 мин с обратным холодильником. Смесь оставляют на ночь и выпавший в осадок гидрохлорид триэтиламина фильтруют. Ацетон, содержащий маточный раствор концентрируют. Маслянистый остаток кристаллизуют при охлаждении. Полученные таким образом практически белые кристаллы промывают водой и фильтруют.

После сушки полученный 3-фенил-3-метил-N-карбэтокси-сукцинимид при желании перекристаллизовывают из 96%-ного спирта. Выход 13,75 г (52%), т. пл. 32-34°С.

Перечисленные в табл. 1 соединения общей формулы



получают согласно описываемому в примере 1 способу из замещенных малеинимидов.

Пример 40. Аналогично примеру 1 получают соединение 3-фениламино-4-(*изо*-бутилтио)-N-карбометокси-малеинимид, т. пл. 113-115°С.

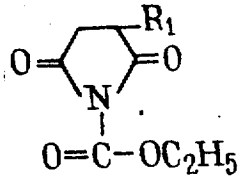
Пример 41. Аналогично примеру 1 получают соединение 3-фениламино-4-этилтио-N-карбометокси-малеинимид, т. пл. 83-86°С.

Пример 42. Аналогично примеру 1 получают соединение 3-фениламино-4-бензилтио-N-карбометокси-малеинимид, т. пл. 150-151°С.

Пример 43. Аналогично примеру 1 получают соединение 3-фениламино-4-циклогексилтио-N-карбометокси-малеинимид, т. пл. 131-134°С.

Пример 44. Аналогично примеру 1 получают соединение 3-фениламино-4-хлор-N-карбометокси-малеинимид, т. пл. 155-157°С.

Пример 45-47. Перечисленные в табл. 2 соединения общей формулы



получают согласно примеру 6 из соответствующих замещенных сукцинимидов указанной общей формулы.

Гербицидное действие общей формулы подтверждено следующими примерами.

Пример 48. Испытание на торможение прорастания.

В качестве исследуемых растений применяют горчицу (Синапись альба) и щетинник (Сетария сп.). Исследуемое действующее начало используют в дозе 10 мг (чашка Петри), а торможение прорастания оценивают через одну неделю после прорастания в темноте (%) по сравнению с необработанными контрольными растениями.

Пример 49. Предвсходовое испытание.

Семена исследуемых растений горчицы и щетинника высевают в посуды для культивирования. Действующее начало наносят затем на почву в количестве 20 кг/га и сосуд для культивирования выставляют на одну неделю в теплицу. Гербицидное действие оценивают (%) через одну неделю по сравнению с необработанными контрольными растениями.

Пример 50. Послевсходовое испытание.

Листву однонедельных исследуемых растений горчицы и щетинника опрыскивают составом действующего начала, соответствующим дозе действующего начала 20 кг/га. Гербицидное действие оценивают через одну неделю (%) в сравнении с необработанными контрольными растениями.

Полученные результаты приведены в табл. 3.

В табл. 4 даны кодовые номера соединений.

В качестве промежуточных продуктов для синтеза новых производных урацил- и дигидроурацилкарбоновых кислот, проявляющих фармакологическую активность, используют следующие соединения.

Пример 51. 5,2 г (0,02 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида растворяют при перемешивании в 250 мл спирта. К смеси добавляют по каплям 115 мл 2,5%-ного водного раствора гидроокиси калия. Реакционную смесь нагревают в течение 1 ч до кипения и после этого выпаривают приблизительно до 30 мл. Продукт осаждают при помощи 5 н. соляной кислоты, фильтруют и перекристаллизовывают из воды. Полученные белые кристаллы плавятся при 254-263°С (разложение). Получают 4,1 г (88,3%) 1-фенил-урацил-6-карбоновой кислоты.

Пример 52. 2,6 г (0,01 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида суспендируют в 52 мл 1-молярного водного раствора гидроокиси калия. Реакционную смесь нагревают до 65°С и выдерживают в течение 2 ч при этой температуре. Реакционную смесь выпаривают приблизительно до 15 мл, и продукт осаждают добавлением 5 н. соляной кислоты. Образованные белые кристаллы отфильтровывают, сушат и перекристаллизовывают из водного спирта. Получают 2,1 г (90,5%) 1-фенилурацил-6-карбоновой кислоты, т. пл. 254-263°С (разложение).

Пример 53. 2,6 г (0,01 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида суспендируют в 52 мл 1-молярного водного раствора гидроокиси калия. Реакционную смесь нагревают до 65°С и выдерживают при этой температуре в течение 2 ч. Реакционную смесь охлаждают и добавляют 30 мл катионообменной смолы типа "Варион КС" в H^+-форме. После 1/2 ч перемешивания смолу отфильтровывают, маточный раствор выпаривают досуха и полученный кристаллический продукт перекристаллизовывают из водного этанола. Получают 2,14 г (92,2%) 1-фенилурацил-6-карбоновой кислоты без кристаллического спирта, т. пл. 253-263°С (разложение).

Пример 54. 2,6 г (0,01 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида суспендируют в 50 мл 0,5 молярного водного раствора гидроокиси натрия. Реакционную смесь нагревают до 65°С, выдерживают в течение 2 ч при этой температуре и после этого охлаждают. Добавляют 30 мл катионообменной смолы типа "Варион КС". Реакционную смесь перемешивают в течение 1/2 ч при комнатной температуре, смолу отфильтровывают и маточный раствор выпаривают досуха. Полученный кристаллический продукт перекристаллизовывают из воды. Получают 2,12 г (91,3%) 1-фенилурацил-6-карбоновой кислоты, т. пл. 253-262°С (разложение).

Пример 55. 2,6 г (0,01 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида суспендируют в растворе 7,85 г (0,025 моль) гидроокиси бария и 385 мл воды. Реакционную смесь нагревают до 65°С, выдерживают в течение 2 ч при этой температуре и затем охлаждают. Добавляют 30 мл катионообменной смолы типа "Варион КС", и смесь перемешивают 1/2 ч при комнатной температуре. Смолу удаляют

фильтрованием и маточный раствор выпаривают досуха. Полученный кристаллический продукт перекристаллизовывают из воды. Получают 2,26 г (97,4%) 1-фенил-урацил-6-карбоновой кислоты, т. пл. 255-264°С (разложение).

Пример 56. 2,6 г (0,01 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-малеинимида растворяют в 235 мл безводного спирта, и раствор добавляют при перемешивании в раствор 1,68 г (0,03 моль) гидроокиси калия в 110 мл безводного спирта. Реакционную смесь перемешивают в течение 1/2 ч при комнатной температуре и после этого нагревают в течение 1 ч до кипения. Раствор выпаривают приблизительно до 70 мл, и осажденный продукт отфильтровывают. Получают 2,89 г (93,5%) дикалиевой соли 1-фенилурацил-6-карбоновой кислоты, т. пл. 295-305°С (разложение).

Пример 57. 7,86 г (0,03 моль) 3-фениламино-N-карбэтокси-сукцинимида суспендируют в 156 мл 1-молярного водного раствора гидроокиси калия. Суспензию перемешивают при комнатной температуре в течение 1 ч. Образуется прозрачный раствор. Затем добавляют 90 мл катионообменной смолы типа "Варион КС" в H^+-форме. После 1 ч перемешивания при комнатной температуре смесь фильтруют, и раствор выпаривают досуха. Маслянистый остаток кристаллизуют при охлаждении. Кристаллы перекристаллизовывают из водного ацетона. Выход 2,31 г (30,6%) 1-фенил-дигидроурацил-6-карбоновой кислоты, т. пл. 206-213°С.

Пример 58-73. Приведенные в табл. 5 соединения указанной формулы получают аналогично описанному в примерах 51-56 способу их соответствующих соединений.

Полученные по примерам 63,65,69, 70 и 72 соединения содержат 1 мол. кристаллизационной воды, соединения по примеру 68 - 2 мол. кристаллизационной воды, соединение по примеру 73 - 1 мол. кристаллического спирта.

Примеры 74-84. Соединения указанной общей формулы получают по примеру 51 с применением соответствующих исходных веществ, приведенных в табл. 6.

Аналогично примеру 57 из соответствующих соединений получают соединения в форме карбоксильных монокалиевых солей концентрированием реакционного раствора и отфильтровыванием осажденного продукта.

Таким образом, новые соединения предлагаемой общей формулы обладают гербицидным действием и кроме того, являются полупродуктами для синтеза фармакологически активных препаратов, расширяя тем самым средства воздействия на живой организм.

Таблица 1

Пример	R	R_1	Выход, %	Температура плавления, °С
1	2	3	4	5
7	Водород	4-Метил-фенил-амино-	85,7	186-89
8	-"-	-"-	70	166-69
9	-"-	4-Хлор-фениламино-	63	230-248
10	-"-	4-Бром-фениламино-	78	240-45
11	-"-	Бензиламино-	68,4	86-90
12	-"-	2-(3,4-Диметокси--фенил)-этиламино-	68,9	108-112

Продолжение табл 1.

1	2	3	4	5
13	-"-	н -Бутиламино-	90	77-80
14	-"-	Циклогексиламино-	92	92-96
15	Хлор	Амино-	80	174-80
16	-"-	Фениламино-	84	120-26
17	-"-	4-Метил-фениламино-	81	135-40
18	-"-	4-Метокси-фениламино-	84,3	158-63
19	-"-	4-Хлор-фениламино-	76,8	190-99
20	-"-	3-Хлор-фениламино-	53,6	150-161
21	-"-	3,5-Дихлор-фениламино-	89	200-207
22	-"-	4-Бром-фениламино-	87	190-98
23	-"-	2-Нафтиламино-	74	170-75
24	-"-	Фениламино-	83	132-34
25	-"-	-"-	85,6	133-35
26	Фенил-сульфонил	-"-	72,5	205-206
27	Водород	н -Гексиламино-	67	56-59
28	Хлор	2-Метил-фениламино-	85	116-119
29	Фенил-	Бензиламино-	73	109-111
30	-"-	н -Гексиламино	80	46-47
31	-"-	Октиламино-	81	68-70
32	-"-	Циклогексиламино-	84	87-89
33	-"-	н -Бутиламино-	83	63-64
34	Водород	Фурфуриламино-	95	79-83
35	Циклогексилтио	Фениламино-	88	114-116
36	Бензилтио-	-"-	89	107-108
37	изо -Бутилтио-	-"-	89	86-88

Продолжение табл 1.

1	2	3	4	5
38	Этилтио-	-"-	90	70-71
39	4-Метил-фенилсульфонил	-"-	58	182-184

Таблица 2

Пример	R_1	Выход, %	Температура плавления, °С
45	Фениламино	67	102-105
46	3-Метил-фенил-амино-	58,8	94-99
47	4-Хлор-фенил-амино	89	130-133

Таблица 3

Кодовый номер	Торможение прорастания, %		Предвсходовое действие, %		Послевсходовое действие, %	
	Щетинник	Горчица	Щетинник	Горчица	Щетинник	Горчица
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

Продолжение табл.3

Кодовый номер	Торможение прорастания, %		Предвсходовое действие, %		Послевсходовое действие, %	
	Щетинник	Горчица	Щетинник	Горчица	Щетинник	Горчица
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

Таблица 4

Кодовый номер	Соединение
1	2
971	3-Фениламино-N-карбэтокси-малеинимид
1144	3-Циклогексиламино-N-карбэтокси-малеинимид
1223	3-Фениламино-4-хлор-N-карбэтокси-малеинимид
1225	3-(4-Метил-фениламино)-4--хлор-N-карбэтокси-малеинимид
1227	3-(4-Метокси-фениламино)--4-хлор-N-карбэтокси-малеинимид

Продолжение табл. 4

1	2
1243	3-Амино-4-хлор-N-карбэтокси-малеинимид
1271	3-(4-Хлор-фениламино)-4--хлор-N-карбэтокси-малеинимид
1272	3-(3,5-Дихлор-фениламино)--4-хлор-N-карбэтокси-малеинимид
1473	3-Фенилсульфонил-N-карбэтокси-малеинимид
1524	3-н-Бутиламино-N-карбэтокси-малеинимид
1527	3-Фениламино-N-карбэтокси-сукцинимид
1528	3-(3,4-Диметокси-фенил-этиламино)-N-карбэтоксималеинимид
1532	3-(бета-Нафтиламино)-4-хлор--N-карбэтокси-малеинимид
1539	3-(4-Метил-фениламино)-N--карбэтокси-сукцинимид
1541	3-(4-Хлор-фениламино)-N--карбэтокси-сукцинимид
1542	3-(н-Гексиламино)-N-карбэтокси-малеинимид
1622	3-Фениламино-4-фенилтио--N-карбэтокси-малеинимид
1662	3-Фениламино-4-фенилсульфонил-N-карбэтокси-малеинимид
1667	3-Фениламино-4-(изо-бутилтио)-N-карбэтокси-малеинимид
1668	3-Фениламино-4-(изо-бутилтио)-N-карбэтокси-малеинимид
1670	3-Фениламино-4-бензилтио-N--карбэтокси-малеинимид
1673	3-Фениламино-4-циклогексилтио-N-карбэтокси-малеинимид

Таблица 5

Пример	R	R_1	Выход, %	Точка плавления, °С	Метод по примеру
1	2	3	4	5	6
58	Водород	4-Метил-фенил	91,4	258-264	1
			96	256-263	3
59	-"-	4-Метокси-фенил	95	253-256	1
			94,5	250-256	3
60	-"-	4-Хлор-фенил	95	252-255	1
			86	252-257	3
61	-"-	4-Бром-фенил	81	249-257	3
62	-"-	Бензил	75	225-233	1
63	-"-	2-(3,4-Диметокси-фенил)-этил	88	236-240	2
64	Хлор	Водород	79	294-297	2
			72	287-294	3
65	-"-	Фенил	85	259-262	2
			88	260-264	3
66	-"-	4-Метил-фенил	84	196-204	3
67	-"-	4-Метокси-фенил	74	196-206	2
			88,5	197-202	3
68	-"-	4-Хлор-фенил	84	264-267	2
		7	70,6	262-267	3
69	-"-	3-Хлор-фенил	79,6	180-185	3

Продолжение табл 5.

1	2	3	4	5	6
70	-"-	3,5-Дихлорфенил	76	192-195	3
71	-"-	4-Бромфенил	93	265-270	3
72	Фенил	Фенил	79,0	232-238	3
73	Фенилтио	-"-	77,2	150-160	3

Таблица 6

Пример	R	R_1	Выход, %	Точка плавления, °С	Растворитель, содержащийся в кристаллах, мол
74	Водород	Циклогексил	27,0	234-237	0,5 H_2O
75	-"-	н-Бутил	48,0	213-209	-
76	-"-	н-Гексил	29,3	196-202	-
77	Фенил	Бензил	60,8	126-132	Этанол
78	-"-	н-Бутил	57,0	84-89	Вода
79	-"-	Циклогексил	40,9	234-236	1,5 H_2O
80	Циклогексилтио	Фенил	55,5	140-145	Ацетон
81	Бензилтио	-"-	64,5	124-127	H_2O
82	Водород	2-Фурилметил	48,2	181-185	H_2O
83	2-Метилпропилтио	Фенил	60,0	113-116	H_2O
84	Водород	Фенилэтил	46,2	225-227	-
85	Фенил	н-Гексил	41,6	72-74	1,5 H_2O
86	Водород	3,4-Диэтоксифенил	43,2	199-203	-

СОЮЗ СОВЕТСКИХ СОЦИАЛИСТИЧЕСКИХ РЕСПУБЛИК

(19) SU (11) 1282814 A3

(51) 4 C 07 D 207/404, 207/448

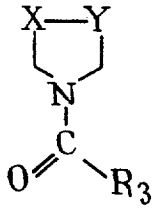
ГОСУДАРСТВЕННЫЙ КОМИТЕТ СССР ПО ДЕЛАМ ИЗОБРЕТЕНИЙ И ОТКРЫТИЙ

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

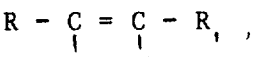
К ПАТЕНТУ

(21) 2640407/23-04
(22) 24.07.78
(31) C1-1757
(32) 25.07.77
(33) HU
(46) 07.01.87. Бюл. № 1
(71) Хиноин Дьедьсер еш Ведьесети Термекек Дьяра РТ (HU)
(72) Ене Шереш, Иштванне Дароци, Яношне Варконьи, Габор Хорват, Илдико Силадьи и Белани Радвани (HU)
(53) 547.298.1.07(088.8)
(56) Патент США № 3882145, кл. C 07 D 239/22, опублик. 1962.

(54)(57) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ПРОИЗВОДНЫХ МАЛЕИНИМИДА И СУКЦИНИМИДА общей формулы



где X - Y представляет собой группу

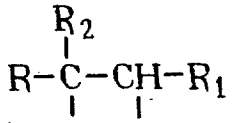


где R_1 - фениламиногруппа, которая может быть замещена алкилом C_1-C_8, метоксилом C_1-C_4, одним или двумя атомами галоида, циклогексиламиногруппа, бензиламиногруппа, фурфуриламиногруппа, нафтиламиногруппа, аминогруппа;

R - водород, хлор, фенил, который может быть замещен метилом; фенилтио, фенилсульфонил, циклогексилтио, бензилтио, алкилтио C_1-C_4, сульфонил;

R_3 - алкоксил C_1-C_4, бензокси

или X - Y представляет собой группу

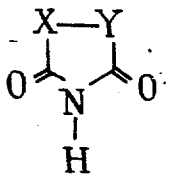


где R - фенил, водород;

R_1 - водород, фениламиногруппа, которая может быть замещена метилом или хлором;

R_2 - алкил C_1-C_4, водород,

отличающийся тем, что соединение общей формулы



где X - Y имеет указанное значение, подвергают взаимодействию с ацилирующим агентом общей формулы

$$R_3 - CO - Cl,$$

где R_3 имеет указанное значение.

SU (11) 1282814 A3