



(12)

BREVET DE INVENTIE

Hotarirea de acordare a brevetului de inventie poate fi revocata
in termen de 6 luni de la data publicarii

(21) Nr. cerere: **145584**

(22) Data de depozit: **18.07.90**

(30) Prioritate:

(41) Data publicarii cererii:
BOPI nr.

(42) Data publicarii hotaririi de acordare a brevetului:
31.05.93 BOPI nr. 5/93

(45) Data publicarii brevetului:
BOPI nr.

(61) Perfectionare la brevet:
Nr.

(62) Divizata din cererea:
Nr.

(86) Cerere internationala PCT:
Nr.

(87) Publicare internationala:
Nr.

(56) Documente din stadiul tehnicii:
SU 737399; JP 7528437; *Chemical Abstracts* 82,
1975, 14007 y

(71) Solicitant: Intreprinderea de Medicamente S.C. "Terapia", Cluj-Napoca, RO

(73) Titular: S.C. "Terapia" S.A., Cluj-uapoca, RO

(72) Inventatori: Bortos Tiberiu-Ioan, Schenker Mariana-Nicoleta, Rusu Mihai, Ghilea Ioan-Marius, Musat Sterian,
Todor Viorel, RO

(54) Procedeu de preparare a 1-metil-5-formilamino-6-aminouracilului

(57) Rezumat: Inventia se refera la un procedeu de preparare a 1-metil-5-formilamino-6-aminouracilului pornind de la acidul 1-metil-6-iminovioluric, prin reducerea acestuia cu aluminiu, in solutie

apoasa diluata, de acid formic, la temperatura de 40...60°C; in aceeaasi etapa preparativa, are loc si formilarea diaminei rezultate ca produs primar in urma reducerii.

Revendicari: 1

RO 106562 B1



Prezenta invenție se referă la un procedeu de preparare a 1- metil-5-formilamino-6-aminouracilului, pornind de la acidul 1- metil-6-iminovioluric.

Procedeele cunoscute de obținere a derivaților formilați ai 5,6- diaminouracilului, care la rândul său se obține din nitrozo- derivat prin reducerea cu zinc, sulfuri sau hidrogenare catalitică, recurg la încălzirea diaminei în acid formic concentrat la fierbere sau în formamidă de asemenea la fierbere.

Dezavantajele metodelor cunoscute constau în aceea că este necesar să se utilizeze acid formic de concentrație minimum 87%, la o temperatură relativ ridicată, sau formamidă la o temperatură și mai înaltă, randamentele situându-se în toate cazurile între 61...87%.

Procedeu conform invenției înlătură aceste dezavantaje prin aceea că reducerea acidului 1-metil-6-iminovioluric se realizează cu aluminiu în soluție apoasă de acid formic circa 25%, la temperatura de 40...60°C, în aceste condiții, reducerea și formilarea având loc într-o singură etapă preparativă, randamentul global fiind 84...85%.

Invenția prezintă avantaje, prin aceea că reacțiile au loc într-o singură fază, formilarea decurgând în condiții blânde,

problemele de coroziune fiind minime.

Se dă, în continuare, un exemplu de realizare a invenției.

În 700 g acid formic 25% se dizolvă 9 g clorură de sodiu, după care se suspendă 84 g sare de sodiu a acidului 1-metil-6-iminovioluric; suspensia se încălzește la 40°C și în decurs de 4 h se introduc în porțiuni 20 g aluminiu span, menținând temperatura între 40...60°C, după terminarea adăugării aluminiului, reacția se perfectează 4 h la 40...60°C, după care amestecul se răcește la 20°C și se filtrează; substanța solidă alb-gălbui se spală cu apă, până când apele devin incolore, se esorează și se usucă la 80°C. Se obțin 67,6 g 1-metil-5-formilamino-6-aminouracil. Randament 84%.

Revendicare

Procedeu de preparare a 1-metil-5-formilamino-6-aminouracilului prin reducerea acidului 1-metil-6-iminovioluric, caracterizat prin aceea că, reducerea se efectuează cu aluminiu, în mediu de acid formic, diluat la 40...60°C și în prezența unui electrolit, condiții când are loc și formilarea subsecventă a diaminei care nu se izolează ca intermediar.

Președintele comisiei de invenții: biolog Nicola Nicolin
Examinator: ing. Orășeanu Cornelia