

URZĄD PATENTOWY



C 07 d 51/42

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 28248.

Kl. 12 p, 7/01.

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft
(Bazyleja, Szwajcaria).

Sposób wytwarzania 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidyny.

Zgłoszono 21 stycznia 1938 r.

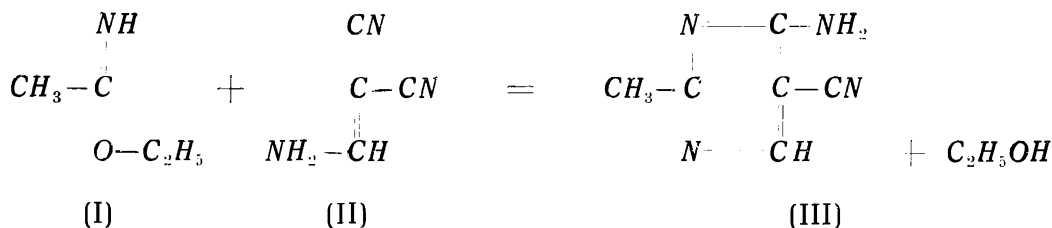
Udzielono 24 marca 1939 r.

Pierwszeństwo: 24 lutego 1937 r. (Szwajcaria).

Do wytwarzania pirymidyn stosuje się przeważnie amidyny. Amidyny kondensowano już ze związkami oksymetylenowymi względnie ze związkami alkylooksymetylenowymi w celu wytwarzania pirymidyn. W ten sposób wytworzono 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidynę przez działanie acetoamidyny na nityl etoksymetylenomalonowy (Hoppe-Seylera „Zeitschrift

für physiologische Chemie“, 242, 1936, str. 95).

Znaleziono obecnie, że 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidynę (III) można otrzymać łatwiej i z dobrą wydajnością, działając acetoiminoeterem (I) na nityl aminometylenomalonowy (II). Reakcja przebiega według następującego równania:



W przeciwieństwie do powyżej wymienionego znanego sposobu otrzymywania 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidyny sposób otrzymywania tego związku według wynalazku niniejszego wyróżnia się zasadniczo tym, że jako ciała wyjściowe stosuje się związek aminometylenowy i eter iminowy, które wytwarzają pirymidynę przy zamykaniu się pierścienia z wydzieleniem alkoholu.

2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidyna stanowi półprodukt przy wytwarzaniu aneuryny.

Przykład. 5 części wagowych nitrilu aminometylenomalonowego, wytworzonego przez działanie na nitril etoksymetylenomalonowy 25%-owym amoniakiem (o punkcie topnienia 140°C) i 6 części wagowych chlorowodoru acetoiminoeteru rozpuszcza się razem w 30 częściach wagowych alkoholu absolutnego w temperaturze około 70°C. Następnie powstały roztwór studzi się do 40°C i dodaje roztwór 1,1 części wagowej sodu w 20 częściach wagowych alkoholu absolutnego. Natychmiast wydziela się chlorek sodu i temperatura podnosi się do 45 — 50°C. W tem-

peraturze tej utrzymuje się mieszaninę reakcyjną w ciągu 1 godziny, po czym w ciągu 12 godzin pozostawia w temperaturze 20 — 30°C. Wytworzona 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidyna wypełnia naczynie, w którym przeprowadzano reakcję, w postaci słabożółtej masy kryształicznej; odsysa się ją i przemywa 50 częściami wagowymi wody. W celu oczyszczenia przekrystalizowuje się otrzymany związek z alkoholu metylowego, po czym otrzymuje się związek o punkcie topnienia 249°C z wydajnością wynoszącą 76% wydajności teoretycznej.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób wytwarzania 2 - metylo - 4 - amino - 5 - cyjanopirymidyny, znamieny tym, że na nitril aminometylenomalonowy działa się acetoiminoeterem.

F. Hoffmann - La Roche & Co.
Aktiengesellschaft.
Zastępca: Inż. Cz. Raczyński,
rzecznik patentowy.