

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



ÚRAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

261697

(11)

(B1)

(51) Int. Cl.⁴
C 07 D 239/54

(22) Prihlášené 03 12 87

(21) (PV 8787-87.L.)

(40) Zverejnené 15 07 88

(45) Vydané 15 05 89

(75)

Autor vynálezu

VEVERKA MIROSLAV ing. CSc., ŠTIBRÁNYI LADISLAV ing. CSc.,
BRATISLAVA, JENDRICHOVSKÝ JÁN ing. CSc., MODRA,
NEVYDAL JOZEF ing., HLOHOVEC

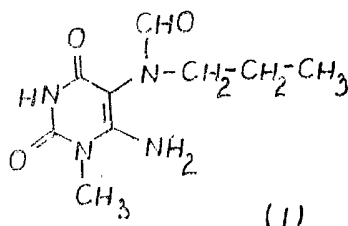
(54) 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)-amíno-6-amínouracil a spôsob jeho
prípravy

1

2

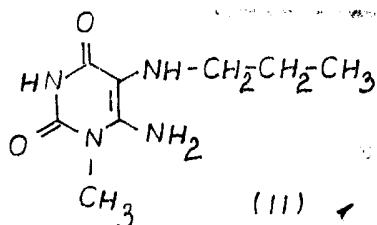
Predmetom riešenia je 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amíno-6-amínouracil a jeho príprava reakciou 1-metyl-5-n-propylamíno-6-amínouracilu s kyselinou mravčou alebo jej reaktívnymi derivátmi. Zlúčenina sa používa ako medziprodukt pre prípravu liečiva kardiovaskulárneho systému.

Vynález sa týka nového 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu vzorca I



a spôsobu jeho prípravy.

Zlúčenina vzorca I sa používa ako medzi-produkt pre prípravu liečiva kardiovaskulárneho systému. Zlúčenina vzorca I sa pripravuje reakciou 1-metyl-5-n-propylamino-6-amínouracilu vzorca II



s kyselinou mravčou alebo jej reaktívnymi derivátmi, ako zmesným anhydridom alebo reaktívnym esterom v organickom alebo vodnoorganickom prostredí pri teplote 15 °C až 150 °C.

Postup prípravy zlúčeniny vzorca I podľa vynálezu sa uskutočňuje tak, že sa k 1 mólu zlúčeniny vzorca II pridá 0,8 až 5 mólov kyseliny mravčej alebo jej reaktívneho derivátu, ako zmesného anhydridu alebo reaktívneho esteru. Ako zmesný anhydrid možno použiť najmä anhydrid vytvorený s kyselinou octovou, ako reaktívny ester p-nitrofenylester kyseliny mravčej, ako uvádza napr. Mc Omie, J. F. W. (ed) („Protective group in organic chemistry“. New York, Plenum Press 1973). Formylácia s kyselinou mravčou sa môže uskutočniť aj v prítomnosti rozpúšťadla alebo priamo v jej nadbytku.

Ako rozpúšťadlo sa môže použiť voda alebo rozpúšťadlo inertné za podmienok reakcie, ako xylén.

Podrobnosti jednotlivých spôsobov prípravy sú uvedené v nasledujúcich príkladoch prevedenia, bez toho, že by sa na tieto výlučne obmedzovali.

Príklad 1

61,5 g 1-metyl-5-n-propylamino-6-amínouracilu a 150 ml kyseliny mravčej sa za miešania refluxuje počas 90 minút. Reakčná zmes sa zahusť za vákua a k zvyšku sa pridá 80 mililitrov etanolu, zahreje sa do varu a prefiltruje. Vysušením sa získa 63,7 g 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu s t. t. 238 až 243 °C.

Príklad 2

19,8 g 1-metyl-5-n-propylamino-6-amínouracilu sa pridá do 50 ml zmesného anhydridu kyseliny octovej a mravčej a reakčná zmes sa mieša pri teplote 50 °C počas 3,5 hodiny. Spracovaním ako v príklade 1 sa získa 22 g 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu.

Príklad 3

0,95 g 1-metyl-5-n-propylamino-6-amínouracilu sa refluxuje s 0,85 g p-nitrofenylesteru kyseliny mravčej v 13 ml dimetylformidu počas 20 minút. Spracovaním ako v príklade 1 sa získa 0,17 g 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu.

Príklad 4

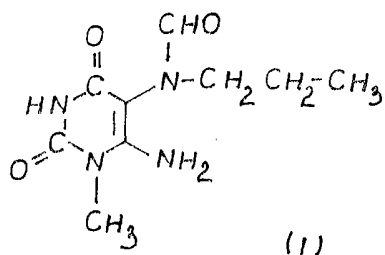
Analogický postup v príklade 1 s tým, že sa použije zmes 150 ml kyseliny mravčej a 50 ml formamidu. Získa sa 60 g 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu.

Príklad 5

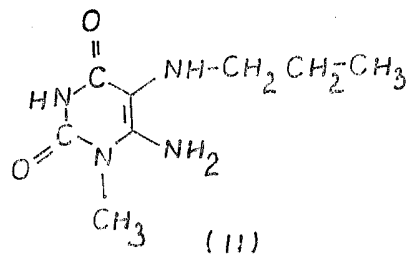
Analogický postup v príklade 1 s tým, že sa použije zmes 150 ml kyseliny mravčej a 15 ml vody. Získa sa 48 g 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-6-amínouracilu.

PREDMET VYNÁLEZU

1. 1-metyl-5-(N-n-propyl-N-formyl)amino-
-6-aminouracil vzorca I



2. Spôsob prípravy zlúčeniny podľa bodu
1 vzorca I, vyznačený tým, že sa na 1-metyl-
-5-n-propylamino-6-aminouracil vzorca II



pôsobí kyselinou mravčou alebo jej reaktív-
nym derivátom, ako zmesným anhydridom
alebo reaktívnym esterom v organickom a-
lebo vodnoorganickom prostredí pri teplote
15 °C až 150 °C.