

7
MALA REPRODUCCION
POR DEFECTO DEL ORIGINAL



PATENTE DE INTRODUCCION
=====

I.C.I. Case D 10409.

920642

MEMORIA DESCRIPTIVA 220642

sobre:

"Procedimiento de fabricación de derivados de pirimidina".

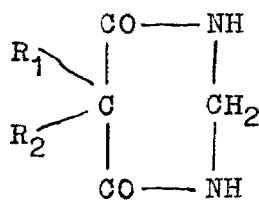
=====

Solicitantes : IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED,
entidad inglesa, residente en Imperial
Chemical House, Millbank, Londres,
Inglaterra.

===

Este invento se refiere a perfeccionamientos en,
o relativos a, la fabricación de derivados de pirimidina
dotados de propiedades anticunvulsivas útiles.

Los derivados de pirimidina con los que este
5. invento se relaciona, son los de la fórmula siguiente:



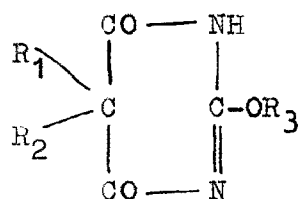
en la que R₁ representa un radical carbocíclico monocíclico,



220642

- y R_2 representa un radical alkilo de no mas de 3 átomos de carbono. Estos compuestos son algunos de los que
10. constituyen el objeto de la memoria nº 19.761/49 (nº de serie 656.027).

De acuerdo con este invento se fabrican los mencionados derivados de pirimidina por un procedimiento que comprende el reducir compuestos de la fórmula:

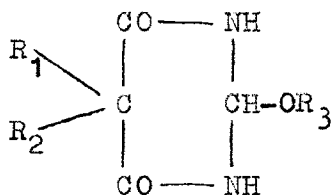


15. en la que R_1 y R_2 tienen los significados antes indicados, y R_3 representa un radical alkilo.

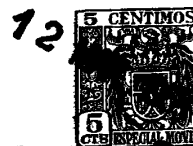
El procedimiento de reducción se lleva a cabo, con preferencia, en un medio neutro o alcalino y se ha comprobado que es adecuada la hidrogenación por medio de

20. catalizadores metálicos, que contengan hidrogeno, finalmente divididos, especialmente la reducción por medio de preparaciones de níquel Raney, que contengan hidrógeno, por ejemplo la descrita como W5 en el Journal of the American Chemical Society, 1948, 70, 695.

25. Puede suponerse, pero se cita solamente por vía de explicación, que la reducción se realiza con la formación intermedia de una substancia de la fórmula:



- en la que R_1 , R_2 y R_3 , tienen los significados antes
30. mencionados.



220642

Este invento se aclara, sin limitarse, por los ejemplos siguientes, en los que las partes son ponderales.

EJEMPLO 1.

35. Se calientan durante 2 horas, sometidas a reflujo, 2 partes de 2-metoxi-5-fenil-5-etiltetrahidropirimidina-4:6-diona, 100 partes de etanol y 10 partes de níquel Raney W5 (preparado como se describe en el Journal of the American Chemical Society, 1948, 70, 695).
40. A continuación se filtra la mezcla todavía caliente, y el filtrado se evapora hasta un pequeño volumen, se enfria y se filtra de nuevo. El residuo sólido está constituido por 5-fenil-5-etilhexahidropirimidina-4:6-diona, punto de fusión 281°C.

45. EJEMPLO 2.

- Se calientan juntas durante 3 horas, sometidas a reflujo, 2 partes de 2-etoxi-5-fenil-5-etiltetrahidropirimidina-4:6-diona, 150 partes de etanol y 15 partes de níquel Raney W5. A continuación se filtra la mezcla
50. y el filtrado se evapora a pequeño volumen, se enfria y se filtra de nuevo. El residuo sólido está constituido por 5-fenil-5-etilhexahidropirimidina-4:6-diona, punto de fusión 281°C.

- La 2-etoxi-5-fenil-5-etiltetrahidropirimidina-
55. -4:6-diona, punto de fusión 104-105°C que se utiliza como material de partida, puede obtenerse condensando cloruro feniletilmalonílico con etil-isourea.

N O T A

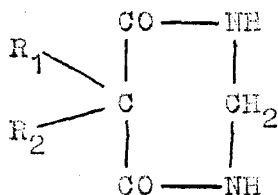
60. Descrita suficientemente la naturaleza del invento, así como la manera de realizarlo en la práctica



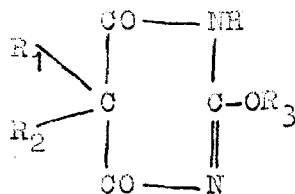
220642

debe hacerse constar que las disposiciones anteriormente indicadas son susceptibles de modificaciones de detalle, en cuanto no alteren su principio fundamental, siendo lo que constituye la esencia del referido invento y por lo que se solicita, Patente de Introducción, por 10 años en España: "PROCEDIMIENTO DE FABRICACION DE DERIVADOS DE PIRIMIDINA", caracterizándose por lo siguiente:

65. 1º.- Procedimiento de fabricación de derivados de pirimidina, caracterizado porque estos son de la fórmula:



70. en la que R₁ representa un radical carbocíclico monocíclico y R₂ significa un radical alquilo de no más de 3 átomos de carbono, y por comprender la reducción de compuestos de la fórmula:



75. en la que R₁ y R₂ tienen los significados antes indicados y R₃ representa un radical alquilo.

80. 2º.- Procedimiento, según lo especificado en la reivindicación 1ª, caracterizado porque la reducción se lleva a cabo en medio neutro o alcalino, empleando catalizadores metálicos finamente divididos y que contengan hidrógeno.



220642

3^a.- Procedimiento de fabricación de derivados
85. de pirimidina; tal y como queda substancialmente descrito
en la presente memoria que consta de cinco hojas, escritas
a máquina por una sola cara.

12 MAR. 1955

Madrid,

IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LIMITED.

J. GÓMEZ ACEBO Y MODET
P.P.