

10 MAR. 1965

307888

P.- 28.362

ES/B 177



MEMORIA DESCRIPTIVA

que se presenta para unir a la solicitud

d e

P A T E N T E D E I N V E N C I O N

formulada el 7 de Enero de 1965, con el número 307.888

e n

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de THE WELLCOME FOUNDATION LIMITED, entidad británica,  
establecida en 133-193, Euston Road, Londres, Inglaterra

por:

"UN METODO DE PRODUCIR UNA 2,4-DIAMINOPIRIDO (2,3-d)  
PIRIMIDINA"

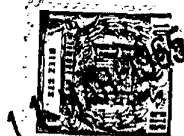
Este invento se refiere a pirido (2,5-d) pirimidinas  
y a su producción, y es una mejora, o una modificación, del  
invento descrito y reivindicado en la memoria completa 26.240/  
61, a la que se hace referencia en lo que sigue como la memo-  
ria citada.

De acuerdo con el presente invento se proporcionan 2,4-diaminopirido (2,3-d) pirimidinas de formula general I, que se pueden producir por el metodo descrito en la memoria citada, es decir tratando una 3-(aminoterciario)acroleina de formula II con un agente halogenante (tal como fosgeno, cloruro

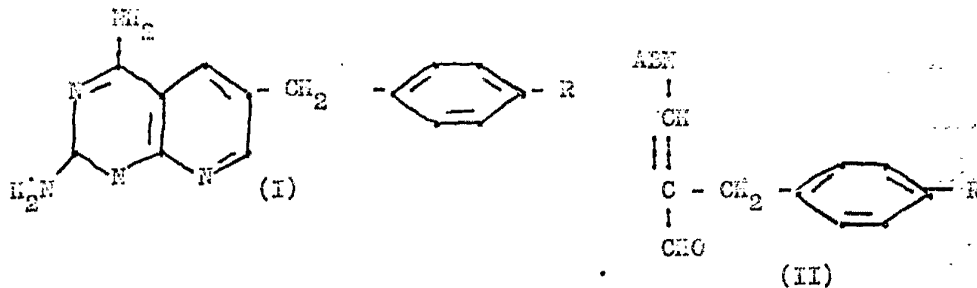
5

10

POOR  
QUALITY



de fosforilo o cloruro de tionilo), calentando el derivado halogenado con 2, 4, 6-triamino-pirimidina y aislando de la mezcla de reacción la 2,4-diaminopirido (2,3-d)pirimidina de formula I desecada.



10 En estas formulas, R es un grupo alcohilo o alcoxi que tiene de 1 a 4 átomos de carbono y ABN es un grupo amino terciario, por ejemplo dimetilamino, dietilamino, pirrolidino o N-metilnilino.

15 Se ha encontrado que las nuevas 2,4-diaminopirido (2,3-d) pirimidinas de formula I son agentes antibacterianos activos con índices quimioterapéuticos similares a los de los productos de la memoria citada; similarmente pueden estar comprendidas en formulaciones farmacéuticas, y pueden ser empleadas como bases libres o como sales de adición ácida que contienen aniones farmacéuticamente aceptables, por ejemplo 20 clorhidratos, sulfatos, malatos, acetatos e isetionatos.

Los siguientes ejemplos ilustran el invento.

EJEMPLO 1:

25 Por el procedimiento descrito en el ejemplo 2 de la memoria citada, se preparó 2,4-diamino-6p-metilbencilpirido (2,3-d) pirimidina como tal sal básica de isetionato (7,92 g.), p. de f. 236-239°C (descomposición), a partir de 3-dimetilamino-2-p-metilbencilacroleína (20,6 g.; 0,145 moles), fosgeno (14,4 g.; 0,145 moles) y 2,4,6-triaminopirimidina (13,2 g.; 0,145 moles). (Encontrado: C, 59,1%; H, 5,5%; N, 22,0%.

30  $2C_{15}H_{15}N_5 \cdot 3H_2O \cdot 4S$  requiere C, 59,5%; H, 5,5%; N, 21,5%).

307888



EJEMPLO 2:

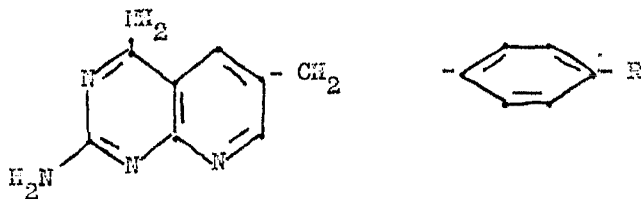
Por el procedimiento descrito en el ejemplo 2 de la memoria citada, se preparó 2,4-diamino-6-p-metoxibencilpirido (2,5-d)pirimidina como el dihidrato de sal basica de isetionato (1,21 g.) p. de f. 280-285°C (descomposición), a partir de 3-dimetilamino-2-p-metoxibencilacroleína (6,48 g., 0,0295 moles), fosgeno (2,92 g; 0,0295 moles) y 2, 4, 6-triaminopirimidina (3,69 g.; 0,0295 moles). (Encontrado: C, 52, 2%; H, 5,45%; N, 19,2%.  $2C_{15}H_{15}N_5O.C_2H_4O_4.2H_2O$  requiere C, 53,0%; H, 5, 4%; N, 19,3%).

Esta solicitud, que corresponde a la presentada en Gran Bretaña el 8 de Enero de 1964 bajo el número 500/64, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

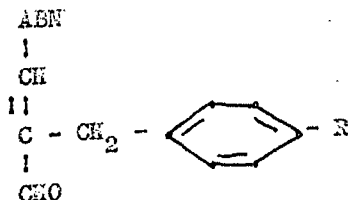
N O T A

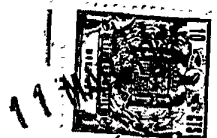
Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Invención en España, por VEINTE años, son los siguientes:

1.- Un método de producir una 2,4-diaminopirido [2,3-d]pirimidina de la fórmula



en la que una 3-(amino terciario) acroleína de la fórmula





es tratada en frio con un agente de halogenación, el derivado halogenado es calentado con 2,4,6-triaminopirimidina, y la 2,4-diaminopirido  $\overline{2,5-d}$  pirimidina deseada es aislada desde la mezcla de reacción, siendo en las fórmulas R un grupo alcohol o alcoxi que tiene de 1 a 4 átomos de carbono y ABN un grupo amino terciario.

2.- Un método según la reivindicación 1, en el que R es un grupo metilo.

3.- Un método según la reivindicación 1, en el que R es un grupo metoxi.

4.- Un método según la reivindicación 1, en el que ABN es un grupo dimetil amino.

5.- Un método según la reivindicación 1, en el que el agente de halogenación utilizado es fosgeno.

6.- Un método de preparar una formulación farmacéutica que comprende la mezcla de una 2,4-diaminopirido  $\overline{2,5-d}$  pirimidina según se ha definido en la reivindicación 1, junto con un vehículo farmacéuticamente aceptable para ella.

7.- UN METODO DE PRODUCIR UNA 2,4-DIAMINOPIRIDO (2,5-d) PIRIMIDINA

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede, y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de cuatro hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

P. A.

11 MAR 1955

Alcance de Efectos  
P. A. P. A.

L.R.V.

- 4 -

M. Ch