

Brevet N° **825**  
du **11.06.1980**  
Titre délivré : **2 A 507 (100)**



Monsieur le Ministre  
de l'Économie et des Classes Moyennes  
Service de la Propriété Intellectuelle  
LUXEMBOURG

## Demande de Brevet d'Invention

### I. Requête

Société Anonyme dite: Société d'Etudes de Produits Chimiques, (1)  
4, rue Théodule Ribot, F-75017 Paris, représentée par

Jean Waxweiler, 21-25 Allée Scheffer, Luxembourg, agissant en (2)  
qualité de mandataire

dépose(nt) ce onze juin mil neuf cent quatre-vingt (3)  
à 15.00 heures, au Ministère de l'Économie et des Classes Moyennes, à Luxembourg :

1. la présente requête pour l'obtention d'un brevet d'invention concernant :

Préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine.

2. la délégation de pouvoir, datée de Paris le 2 juin 1980.

3. la description en langue française de l'invention en deux exemplaires;

4. / planches de dessin, en deux exemplaires;

5. la quittance des taxes versées au Bureau de l'Enregistrement à Luxembourg,

le onze juin mil neuf cent quatre-vingt

déclare(nt) en assumant la responsabilité de cette déclaration, que l(es) inventeur(s) est (sont) :

André Esanu, 5, avenue d'Erlanger, F-75016 Paris (5)

revendique(nt) pour la susdite demande de brevet la priorité d'une (des) demande(s) de

(6) brevet déposée(s) en (7) Grande-Bretagne

le neuf août mil neuf cent soixante dix-neuf sous le no. (8)  
7927811

au nom de Société Anonyme dite: Société d'Etudes de Produits Chimiques (9)

élit(élient) pour lui (elle) et, si désigné, pour son mandataire, à Luxembourg

Jean Waxweiler, 21-25 Allée Scheffer, Luxembourg (10)

solicite(nt) la délivrance d'un brevet d'invention pour l'objet décrit et représenté dans les  
annexes susmentionnées, — avec ajournement de cette délivrance à / mois. (11)

Le mandataire

### II. Procès-verbal de Dépôt

La susdite demande de brevet d'invention a été déposée au Ministère de l'Économie et des  
Classes Moyennes, Service de la Propriété Intellectuelle à Luxembourg, en date du :

11.06.1980

à 15.00 heures



Pr. le Ministre  
de l'Économie et des Classes Moyennes,  
p. d.

Brevet N° **82518**  
du **11.06.1980**  
Titre délivré : .....



Monsieur le Ministre  
de l'Économie et des Classes Moyennes  
Service de la Propriété Intellectuelle  
LUXEMBOURG

## Demande de Brevet d'Invention

### I. Requête

Société Anonyme dite: Société d'Etudes de Produits Chimiques, (1)  
4, rue Théodule Ribot, F-75017 Paris, représentée par

Jean Waxweiler, 21-25 Allée Scheffer, Luxembourg, agissant en (2)  
qualité de mandataire

dépose(nt) ce onze juin mil neuf cent quatre-vingt (3)  
à 15.00 heures, au Ministère de l'Économie et des Classes Moyennes, à Luxembourg :

1. la présente requête pour l'obtention d'un brevet d'invention concernant : (4)

Préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine.

2. la délégation de pouvoir, datée de Paris le 2 juin 1980.

3. la description en langue française de l'invention en deux exemplaires;

4. / planches de dessin, en deux exemplaires;

5. la quittance des taxes versées au Bureau de l'Enregistrement à Luxembourg,

le onze juin mil neuf cent quatre-vingt

déclare(nt) en assumant la responsabilité de cette déclaration, que l'(es) inventeur(s) est (sont) :

André Esanu, 5, avenue d'Erlanger, F-75016 Paris (5)

revendique(nt) pour la susdite demande de brevet la priorité d'une (des) demande(s) de (6)  
brevet déposée(s) en (7) Grande-Bretagne

le neuf août mil neuf cent soixante dix-neuf sous le no. (8)  
7927811

au nom de Société Anonyme dite: Société d'Etudes de Produits Chimiques (9)

élit(élient) pour lui (elle) et, si désigné, pour son mandataire, à Luxembourg

Jean Waxweiler, 21-25 Allée Scheffer, Luxembourg (10)

sollicite(nt) la délivrance d'un brevet d'invention pour l'objet décrit et représenté dans les annexes susmentionnées, — avec ajournement de cette délivrance à / mois. (11)

Le mandataire

*Jean Waxweiler*

### II. Procès-verbal de Dépôt

La susdite demande de brevet d'invention a été déposée au Ministère de l'Économie et des Classes Moyennes, Service de la Propriété Intellectuelle à Luxembourg, en date du :

11.06.1980

à 15.00 heures



Pr. le Ministre  
de l'Économie et des Classes Moyennes,  
p. d.

CO7D

BREVET D'INVENTION.

Société Anonyme dite :  
SOCIETE D'ETUDES DE PRODUITS CHIMIQUES.

Préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine.

(Inventeur : André ESANU)

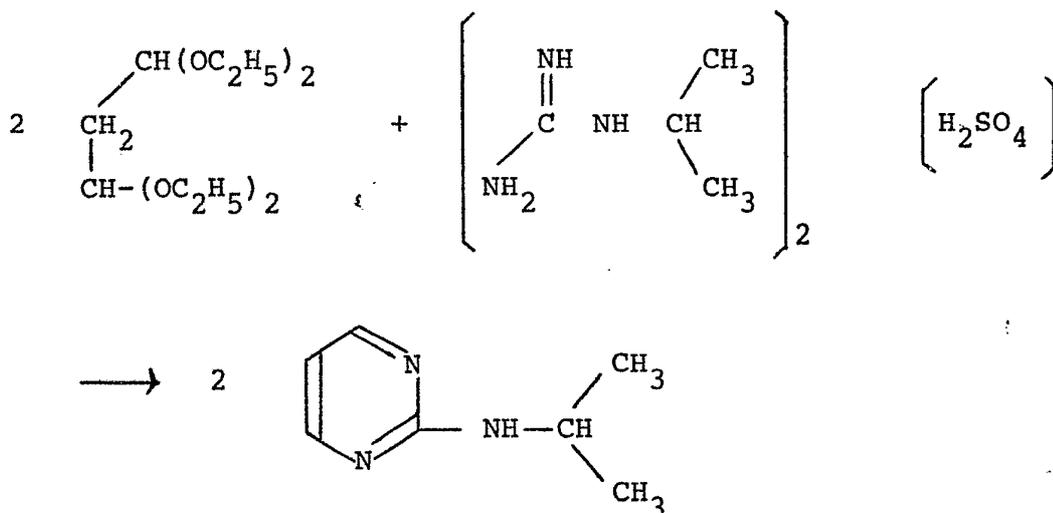
Convention Internationale - Priorité d'une demande de brevet  
déposée en Grande-Bretagne le 9 août 1979 sous le n° 79.27811  
au nom de la déposante.

-----

L'invention concerne un nouveau procédé de préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine, composé utilisé comme intermédiaire dans la préparation de produits pharmaceutiques.

5 On connaît déjà différents procédés pour préparer l'isopropylamino-2 pyrimidine mais aucun n'est vraiment satisfaisant sur le plan du rendement et du coût. Le nouveau procédé, facile à mettre en oeuvre, fonctionne avec des rendements très favorables.

10 L'invention concerne un procédé de préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine, ce procédé comprenant la réaction du sulfate de bis (isopropylguanidine) sur le tétraéthoxy-1,1,3,3-propane, dans des proportions stoechiométriques, à 40-60°C et en solution acide aqueuse.

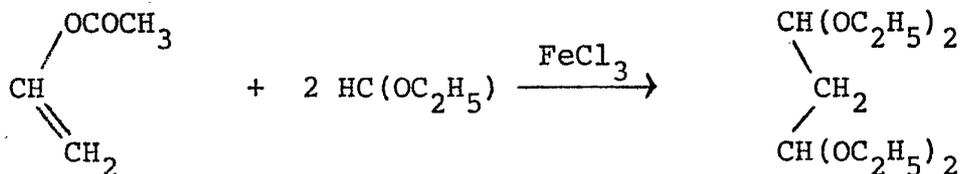


15 Le tétraéthoxy-1,1,3,3-propane peut être préparé en faisant réagir un excès stoechiométrique de triéthyl-orthoformiate sur de l'acétate de vinyl, à 70-90°C, en présence de chlorure ferrique et d'anhydre acétique ; le sulfate de bis (isopropylguanidine) peut être obtenu en faisant réagir  
 20 un excès stoechiométrique d'isopropylamine sur du sulfate de bis (S-méthylisothiourée), au reflux.

L'invention est illustrée par l'exemple suivant :

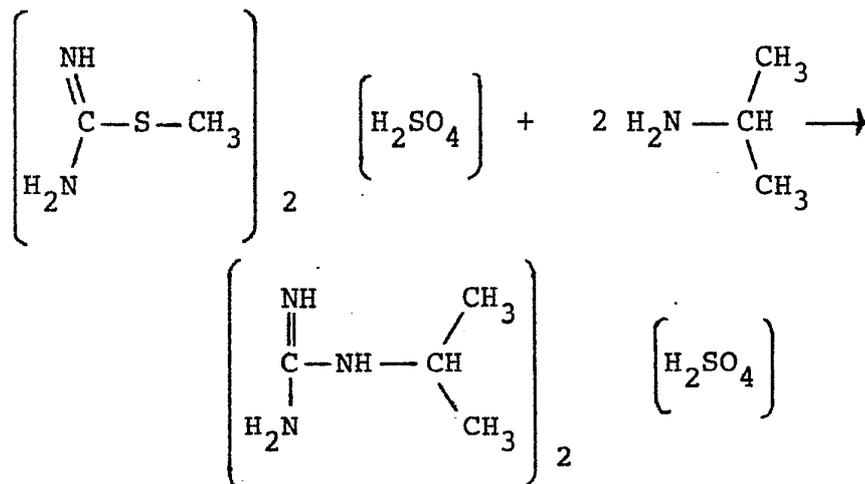
Exemple :

(1) Préparation du tétraéthoxy-1,1,3,3-propane.



Dans un réacteur d'un litre muni de moyens de chauffage, de refroidissement et d'agitation, on verse, sous circulation d'azote, 25,8 g (0,85 mole) de triéthyl orthoformiate. Le mélange est chauffé à 70°C sous agitation. On ajoute ensuite lentement (en 3 heures) 1,4 g de chlorure ferrique et 2,2 g d'anhydre acétique. A la fin de l'addition, on maintient l'agitation pendant une demi-heure et le mélange est ensuite refroidi ; on obtient une composition noire que l'on extrait en utilisant 500 ml d'éther diéthylique. Après avoir lavé et séché l'extrait, l'éther diéthylique est évaporé, donnant un produit huileux qui bout à 100-101°C sous 15 mm de Hg. Rendement 56,8 g (86%).

(2) Préparation du sulfate de bis (isopropylguanidine).



Dans un réacteur d'un litre muni de moyens de chauffage, de refroidissement et d'agitation, on verse 108,5 g (0,39 mole) de sulfate de bis (S-méthylisothiourée), 150 ml d'eau et 94 ml (ou 68 g, i.e. 1,15 mole) d'isopropylamine. Le mélange est porté au reflux pendant 2 heures et ensuite évaporé jusqu'à siccité. Le résidu est repris dans l'éthanol à partir

duquel on obtient, après filtration, lavage et séchage, 96 g (rendement 82%) du produit.

(3) Préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine.

Dans le même réacteur que dans l'étape précédente, on  
5 verse 30 g (0,1 mole) de sulfate de bis (isopropylguanidine),  
120 ml d'eau, 75 ml de solution d'acide chlorhydrique pur  
(d. 1,18) et lentement (en 1 heure et demie), à température  
ambiante, 44 g (0,2 mole) de tétraéthoxy-1,1,3,3-propane. Le  
mélange est alors chauffé à 50-55°C, sous agitation pendant  
10 2 heures, puis refroidi et neutralisé par un excès de solu-  
tion de soude pure. On extrait le mélange en utilisant 300 ml  
d'éther diéthylique. Les extraits sont lavés avec une solu-  
tion saturée de chlorure de sodium, puis séchés et l'éther  
diéthylique est évaporé. On obtient 25 g (rendement 91%)  
15 d'une huile jaunâtre qui bout à 91-91,5°C sous 11 mm de Hg,  
dont l'analyse montre une bonne correspondance avec la  
formule  $C_7H_{11}N_3$ .

REVENDICATION

Procédé de préparation de l'isopropylamino-2 pyrimidine comprenant la réaction de sulfate de bis (isopropylguanidine) sur le tétraéthoxy-1,1,3,3-propane, dans des proportions stœchiométriques, à 40-60°C et en solution acide aqueuse.