

Patentkrav

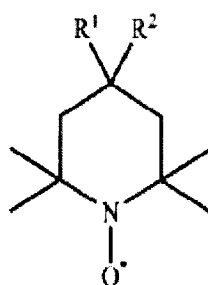
1. Förfarande för framställning av betulinsyra utifrån betulin, **kännetecknat av att** förfarandet innefattar oxidation av betulin till betulinaldehyd med en oxidationsprocess katalyserad med en katalysator på grundval av en rutenium (II)- eller rutenium (VII)förening närvaro av ett oxidationsmedel, och att betulinaldehyden oxideras till betulinsyra.
5
2. Förfarande enligt krav 1, **kännetecknat av att** katalysatorn på grundval en rutenium(II)- eller rutenium(VII)förening är dikloro-*tris*-(trifenylfosfin)- rutenium(II) ($\text{RuCl}_2(\text{PPh}_3)_3$) eller tetra-*n*-propylammoniumperrutenat (TPAP).
10
3. Förfarande enligt krav 1 eller 2, **kännetecknat av att** mängden katalysator på grundval av en rutenium(II)- eller rutenium (VII)förening är omkring 1 till omkring 30 molprocent, beräknat på mängden betulin.
15
4. Förfarande enligt något av föregående krav, **kännetecknat av att** oxidationen av betulin till betulinaldehyd genomförs i ett lösningsmedel valt bland aromatiska kolväten, mättade eller omättade alifatiska kolväten, grenade eller ogrenade alifatiska kolväten, etrar, halogenerade alifatiska kolväten, fluorerade lösningsmedel, estrar, ketoner, H_2O och blandningar därav.
20
5. Förfarande enligt krav 7, **kännetecknat av att** lösningsmedlet är CH_2Cl_2 , DMF, THF, DMSO, perfluoroalkan, toluen, xilen eller blandningar därav.
- 25 6. Förfarande enligt något av föregående krav, **kännetecknat av att** temperaturen under oxidationen av betulin är omkring 0 till omkring 150°C .
7. Förfarande enligt något av föregående krav, **kännetecknat av att** oxidationen av betulin till betulinaldehyd genomförs vid ett tryck av omkring 1 till omkring 50 bar, företrädesvis omkring 1 till omkring 15 bar.
30

8. Förfarande enligt något av föregående krav, **kännetecknat av att** upplösningen av syre i lösningsmedelssystemet under oxidationsprocessen underlättas genom omrörning.

5 9. Förfarande enligt något av föregående krav, **kännetecknat av att** oxidationen av betulin till betulinaldehyd genomförs i närvaro av en bidragande katalysator.

10. Förfarande enligt krav 9, **kännetecknat av att** den bidragande

10 katalysatorn har formeln (5)



5

där var och en av R^1 och R^2 oberoende är väte, alkyl, alkenyl, alkoxi, halo, haloalkyl, hydroxi, hydroxialkyl, aryl, heteroaryl, en heterocykel, cykloalkyl, alkanoyl, alkokikarbonyl, amino, imino, alkylamino, acylamino, nitro, trifluorometyl, trifluorometoxi, karboxi, karboxialkyl, keto, tioxo, alkyltio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, cyano, karboxyl, acetamido, acetoxi, acetyl, bensamido, bensensulfinyl, bensensulfonamido, bensensulfonyl, bensensulfonylamino, bensoyl, bensoylamino, bensoyloxi, bensyl, bensyloxi, bensyloxikarbonyl, bensyltio, karbamoyl, karbamat, isocyanato, sulfamoyl, sulfinamoyl, sulfino, sulfo, sulfamino, tiosulfo, NR^xR^y eller $COOR^x$, varvid varje R^x och R^y oberoende av varandra är H, alkyl, alkenyl, aryl, heteroaryl, en heterocykel, cykloalkyl eller hydroxyl; varvid varje alkylgrupp eventuellt är substituerad på kol med keto ($=O$); varvid varje alkylgrupp eventuellt är avbruten av en eller flera icke-peroxidoxi ($-O-$), tio ($-S-$), imino ($-N(H)-$), metylendioxi ($-OCH_2O-$), karbonyl ($-C(=O)-$), karboxi ($-C(=O)O-$), karbonyldioxi ($-OC(=O)O-$), karboxylato

(-OC(=O)-), imin (C=NH), sulfinyl (SO), sulfonyl (SO₂) eller [SiO]_x, varvid x är omkring 1 till 10 000; eller också är R¹ och R² tillsammans tioxo (=S) eller keto (=O).

- 5 11. Förfarande enligt krav 10, **kännetecknat av att** R¹ är väte och R² är väte, alkyl, alkoxi, haloalkyl, hydroxi, en heterocykel, amino, alkylamino, cyano eller karboxyl; varvid varje alkylgrupp eventuellt är substituerad på kol med keto (=O); varvid varje alkylgrupp eventuellt är avbruten av en eller flera imino (-N(H)-), karbonyl (-C(=O)-) eller [SiO]_x, varvid x är omkring 1 till 10 000; eller
- 10 också är R¹ och R² tillsammans keto (=O).

12. Förfarande enligt krav 10 och 12, **kännetecknat av att** föreningen med formeln (5) är 2,2,6,6-tetrametylpiperidin-1-oxyl (TEMPO).