

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

268 891

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁴

C 07 C 69/767

(21) PV 7625-88.N

(22) Přihlášeno 21 11 88

(40) Zveřejněno 14 08 89

(45) Vydáno 31 10 90

(75)

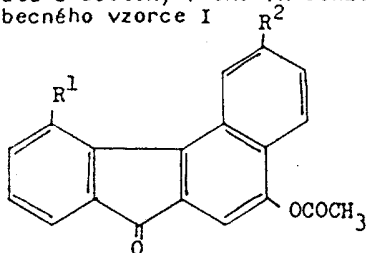
Autor vynálezu

ŠANTRŮČEK MILAN,
KŘEPELKA JIŘÍ ing. CSc., PRAHA

(54)

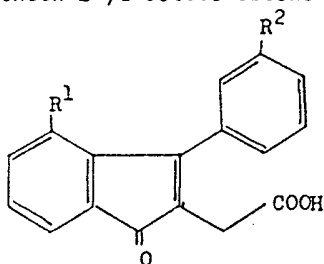
Halogenderiváty 5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)
fluorenu a způsob jejich přípravy

(57) Řešení se týká nových halogenderi-
vátů 5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluorenu
obecného vzorce I



(I),

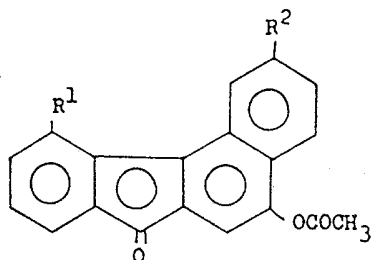
ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor ne-
bo R^1 i R^2 brom, sloužících jako mezi-
stupeň přípravy antineoplasticky účinných
halogenderivátů benzo(c)fluorenu. Jejich
příprava spočívá v reakci odpovídajících
halogenderivátů kyseliny 3-fenyl-1-oxo-
inden-2-yl octové obecného vzorce II



(II),

o výše uvedeném významu R^1 a R^2 s anhy-
dridem kyseliny octové za varu reakční
směsi.

vynález se týká nových halogenderivátů 5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluorenu obecného vzorce I

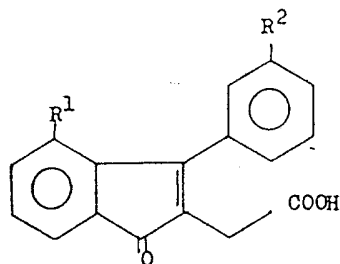


(I),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom.

Látky obecného vzorce I o výše uvedeném významu R^1 a R^2 jsou cennými meziprodukty pro přípravu látek se zajímavými biologickými účinky, především tetracyklických derivátů benzo(c)fluorenu. Deriváty benzo(c)fluorenu vykazují významnou protinádorovou, interferonogenní a antibakteriální aktivitu (Křepelka a spol. Collect. Czech. Chem. Commun. 47, 1258 (1982), 47, 1857 (1982), Vančurová a spol. Collect. Czech. Chem. Commun. 47, 1867 (1982). AO č. 212 669, USA patent č. 4,661,297, Šmejkal a spol. Acta Virol. 29, 11 (1984) a látky obecného vzorce I jsou významnými prekursory při jejich syntéze.

Látky obecného vzorce I o výše uvedeném významu R^1 a R^2 se podle vynálezu připraví z odpovídajících halogenderivátů kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-2-yl octové obecného vzorce II



(II),

(látky obecného vzorce II se připraví podle čs. autorského osvědčení č. 268890), ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom, reakcí s anhydridem kyseliny octové za varu reakční směsi.

Podrobnější údaje o přípravě látek obecného vzorce I o výše uvedeném významu R^1 a R^2 vyplynou z následujícího příkladu provedení, který rozsah vynálezu nijak neomezuje.

Příklad

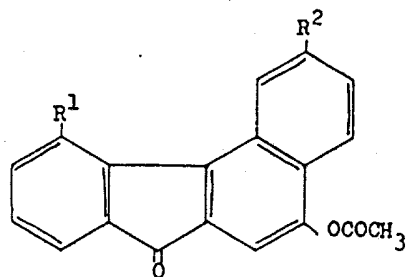
2,11-Dibrom-5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluoren

K 10 g (0,023 mol) kyseliny 3-(3-bromfenyl)-5-brom-1-oxo-inden-2-yl octové předloženým v tříhrdlé baňce opatřené zpětným chladičem a míchadlem bylo přidáno 72 ml (0,76 mol) anhydridu kyseliny octové a reakční směs byla míchána a zahřívána k refluxu (teplota reakční směsi 133 °C) 4 hodiny. Poté byla hnědá reakční směs rychle za míchání ochlazena vodou, čímž byla získána žlutá látka o teplotě tání 182 - 185 °C. Bylo získáno 6,67 g (63,1 %) produktu.

Analogicky byl připraven 2-chlor-5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c) fluoren, teplota tání 226 až 230 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

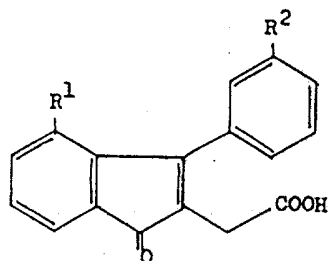
1. Halogenderiváty 5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluorenu obecného vzorce I



(I),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom.

2. 2,11-Dibrom-5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluoren.
3. 2-Chlor-5-acetoxy-7-oxo-7H-benzo(c)fluoren.
4. Způsob přípravy látek podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že odpovídající halogenované kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-2-yl octové obecného vzorce II



(II),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom, se převádějí reakcí s anhydridem kyseliny octové za varu reakční směsi na látky obecného vzorce I o výše uvedeném významu R^1 a R^2 .