



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

252341

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴

C 07 D 471/04

(22) Přihlášeno 08 05 86

(21) PV 3352-86

(40) Zveřejněno 15 01 87

(45) Vydáno 16 05 88

(75)

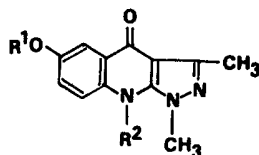
Autor vynálezu

ZIKÁN VIKTOR ing. CSc.,

RÁDL STANISLAV ing. CSc., PRAHA

(54) O,N-substituované 4,9-dihydro-6-hydroxy-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo(3,4-b)chinoliny

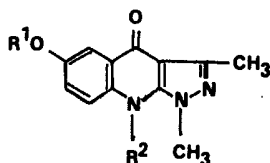
Řešení se týká O,N-substituovaných
4,9-dihydro-6-hydroxy-1,3-dimethyl-4-oxo-
-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolinů obecného
vzorce I



(I)

kde R¹ a R² je atom vodíku nebo metylskupi-
na. Tyto nové, dosud nepopsané látky, jsou
použitelné jako meziprodukty pro přípravu
látek vykazujících významné biologické činky,
účinky, zvláště protivirové a protinádorové
účinky.

Vynález se týká O,N-substituovaných 4,9-dihydro-6-hydroxy-1,3-dimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo-3,4-b/chinolinů obecného vzorce I



/I/

kde R¹ a R² je atom vodíku nebo metylskupina.

Tyto nové, dosud nepopsané látky, jsou použitelné jako meziprodukty pro přípravu látek vykazujících významné biologické účinky, zejména protivirový a protinádorový účinek.

Sloučeninu obecného vzorce I, kde R¹ je metylskupina a R² je atom vodíku, lze podle vynálezu připravit kyselou hydrolýzou 4-chlor-6-methoxy-1,3-dimetyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu varem se zředěnou chlorovodíkovou kyselinou. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R¹ i R² je metylskupina, lze podle vynálezu připravit metylací sodné soli 4,9-dihydro-6-methoxy-1,3-dimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu metyljodidem v dimetylformamidu za teploty místnosti. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R¹ je atom vodíku a R² je metylskupina, lze podle vynálezu připravit z 4,9-dihydro-6-methoxy-1,3,9-trimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu demethylací azeotropickou bromovodíkovou kyselinou.

Způsob přípravy látek je jednoduchý a poskytuje žádané produkty v uspokojivých výtěžcích. Získané produkty jsou přímo použitelné pro další použití. Bližší podrobnosti vyplývají z následujících příkladů provedení. Uvedené příklady vynález pouze ilustrují, nikoliv omezují.

P ř í k l a d 1

4,9-Dihydro-6-methoxy-1,3-dimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

Směs 4-chlor-6-methoxy-1,3-dimetyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu /2,6 g 10 mmol/ a 2M chlorovodíkové kyseliny /25 ml/ byla 6 hodin vařena pod zpětným chladičem. Po ochlazení byl nerozpustný podíl odsát a překrystalován z etanolu. Bylo získáno 1,95 g látky /75 %/ o t.t. 306 až 310 °C

P ř í k l a d 2

4,9-Dihydro-6-methoxy-1,3,9-trimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

K míchané suspenzi 4,9-dihydro-6-methoxy-1,3-dimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu /16,6 g, 68 mmol/ v dimetylformamidu /330 ml/ byl přidán 80% hydrid sodný /2,2 g, 73 mmol/ a směs byla míchána 1 hodinu pod dusíkem. Po přikapání metyljodidu /14,5 g, 0,1 mol/ byla směs míchána 4 hodiny za teploty místnosti, poté byla směs vlita do vody, nerozpustný podíl byl odsát a překrystalován z etanolu. Bylo získáno 10,9 g /63 %/ látky o t.t. 227 až 228 °C.

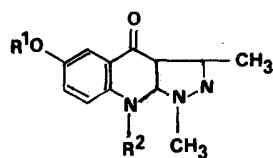
P ř í k l a d 3

4,9-Dihydro-6-hydroxy-1,3,9-trimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

Směs 4,9-dihydro-6-methoxy-1,3,9-trimetyl-4-oxo-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu /2,6 g, 10 mmol/ a azeotropické bromovodíkové kyseliny /35 ml/ byla vařena pod zpětným chladičem 16 hodin. Po ochlazení byl nerozpustný podíl odsát a krystalizací z etanolu bylo získáno 1,95 g látky /80 %/ o t.t. 336 až 340 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

O,N-substituované 4,9-dihydro-6-hydroxy-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo[3,4-b]chinoliny obecného vzorce I



/I/

kde R¹ a R² je atom vodíku nebo metylskupina.