



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY  
A OBJEVY

# POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

**235166**  
(11) (B1)

(51) Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 D 231/38

(22) Přihlášeno 09 09 83  
(21) (PV 6585-83)

(40) Zveřejněno 17 07 84

(45) Vydáno 15 02 87

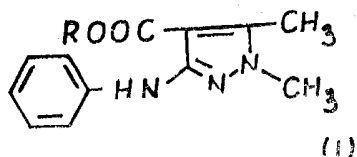
(75)  
Autor vynálezu ZIKÁN VIKTOR ing. CSc., RÁDL STANISLAV ing., PRAHA

(54) Kyselina 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylová  
a její estery a způsoby jejich přípravy

1

2

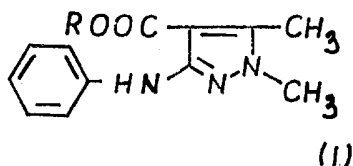
Vynález se týká kyseliny 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové a jejích esterů obecného vzorce I



kde R značí atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, s výhodou ethylskupinu.

Tyto nové, dosud nepopsané látky slouží jako meziprodukty pro syntesu sloučenin s protivirovým účinkem.

Vynález se týká kyseliny 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové a jejích esterů obecného vzorce I



kde R značí atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, s výhodou ethylskupinu.

Uvedené sloučeniny jsou nové a slouží jako meziproducty pro přípravu biologicky významných preparátů, zejména s protivirovým účinkem (čs. autorské osvědčení čí. 255 168).

Uvedené sloučeniny byly připraveny způsobem podle vynálezu, jehož podstata spočívá v tom, že se nejprve alkyluje sodná sůl 3-anilino-4-alkoxykarbonyl-5-methylpyrazolu, kde alkoxykupina obsahuje 1 až 3 atomy uhlíku methyljodidem v dimethylformamidu při teplotě 0 °C až 30 °C, s výhodou při teplotě 20 °C, za vzniku odpovídajícího alkylesteru 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové kyseliny. Vzniklý ester se způsobem podle vynálezu zmýdelní varem s vodně ethanolickým roztokem hydroxidu sodného za vzniku kyseliny 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové.

Následující příklady provedení vynález dokládají, ale nikterak neomezuji.

#### Příklad 1

Ethylester kyseliny 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové

K roztoku 18,5 g 3-anilino-4-ethoxykarbonyl-5-methylpyrazolu [75 mmol] ve 100 ml dimethylformamidu bylo přidáno za míchání pod dusíkem 2,5 g 80% hydridu sodného a směs byla míchána 1 hodinu při teplotě 20 °C. Po přikapání 11,8 g methyljodidu (83 mmol) byla směs míchána další 2 hodiny. Po odsátí nerozpustného podílu byl filtrát odpařen k suchu. Krystalizací odparku z ethanolu bylo získáno 16,7 g látky (85,8 %) o t. t. 90,6 až 91,0 °C.

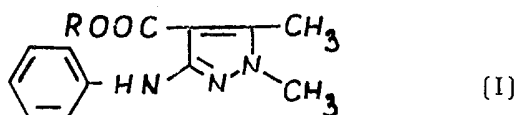
#### Příklad 2

Kyselina 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylová

K roztoku 13 g ethylesteru kyseliny 3-anilino-1,5-dimethylpyrazolkarboxylové (50 mmol) ve 200 ml ethanolu byl při teplotě 50 °C přidán roztok 20 g hydroxidu sodného ve 250 ml vody. Směs byla vařena pod zpětným chladičem 2 hodiny, po ochlazení byl roztok okyselen koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou na pH 4 a vyloučená látka byla odsáta a promyta vodou. Bylo získáno 10,2 g látky (88,2 %) o t. t. 184,5 až 185,7 °C.

#### PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Kyselina 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylová a její estery obecného vzorce I



kde R značí atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, s výhodou ethylskupinu.

2. Způsob přípravy kyseliny 3-anilino-1,5-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové, vyznačující se tím, že alkylester kyseliny 3-anilino-1,5-

-dimethyl-4-pyrazolkarboxylové, kde alkyl je methyl, ethyl nebo propyl, s výhodou ethyl, se zmýdelní varem s vodně ethanolickým roztokem hydroxidu sodného.

3. Způsob přípravy sloučeniny podle bodu 1 vzorce I, kde R je alkylskupina s 1 až 3 atomy uhlíku, s výhodou ethylskupina, vyznačující se tím, že se sodná sůl 3-anilino-4-alkoxykarbonyl-5-methylpyrazolu, kde alkoxykupina obsahuje 1 až 3 atomy uhlíku, s výhodou 3-anilino-4-ethoxykarbonyl-5-methylpyrazolu, alkyluje methyljodidem v dimethylformamidu při teplotě 0 °C až 30 °C, s výhodou při teplotě 20 °C.