



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

252340

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴

C 07 D 471/04

(22) Přihlášeno 08 05 86

(21) PV 3351-86

(40) Zveřejněno 15 01 87

(45) Vydáno 16 05 88

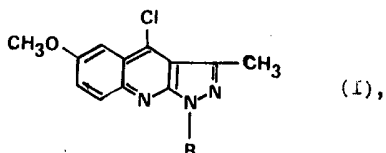
(75)

Autor vynálezu

ZIKÁN VIKTOR ing. CSc., RÁDL STANISLAV ing. CSc., PRAHA

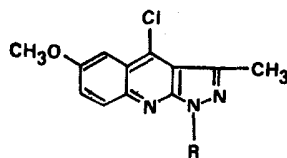
(54) 4-chlor-6-methoxy-3-methyl-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolin a jeho
N¹-methylderivát

Řešení se týká 4-chlor-6-methoxy-
-3-methyl-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolinu
a jeho N¹-methylderivátu obecného vzor-
ce I



kde R je atom vodíku nebo methylskupina.
Tyto nové, dosud nepopsané látky, jsou
použitelné jako meziprodukty pro pří-
pravu látek vykazujících významné biolo-
gické účinky, zejména protivirový a pro-
tinádorový účinek.

Vynález se týká 4-chlor-6-methoxy-3-methyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu a jeho N¹-methylderivátu obecného vzorce I



(I),

kde R je atom vodíku nebo methylskupina.

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 R je atom vodíku, lze podle vynálezu připravit cyklizací 3-(4-methoxyanilino)-5-methyl-1H-pyrazol-4-karboxylové kyseliny oxidochloridem fosforečným. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R je methylskupina, lze podle vynálezu připravit methylací sloučeniny obecného vzorce I, kde R je atom vodíku, dimethylsulfátem v přítomnosti práškového hydroxidu draselného v prostředí aprotického rozpouštědla, výhodně v dimethylsulfoxidu, za teploty místnosti.

Způsob přípravy látek je jednoduchý a poskytuje žádané látky v uspokojivých výtěžcích. Bližší podrobnosti vyplývají z následujících příkladů provedení. Uvedené příklady tento vynález pouze ilustrují, nikoliv omezují.

P ř í k l a d 1

4-chlor-6-methoxy-3-methyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

Směs 3-(4-methoxyanilino)-5-methyl-1H-pyrazol-4-karboxylové kyseliny (4,5 g, 18 mmol) a oxidochloridu fosforečného (40 ml) byla vařena pod zpětným chladičem 1 hodinu. Sirupovitý zbytek získaný oddestilováním přebytku oxidochloridu fosforečného byl nalit na led a směs byla zalkalizována 4M roztokem hydroxidu sodného. Po ochlazení byl nerozpustný podíl odsát a promyt vodou. Krystalizací z chloroformu bylo získáno 4,25 g (94 %) žlutých krystalů o t.t. 232 až 236 °C.

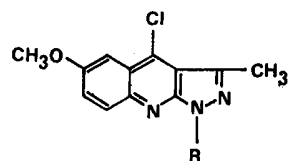
P ř í k l a d 2

4-chlor-6-methoxy-1,3-dimethyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

K suspenzi 4-chlor-6-methoxy-3-methyl-1H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu (9,9 g, 40 mmol) v dimethylsulfoxidu (100 ml) byl přidán práškový hydroxid draselný (2,5 g 45 mmol) a směs byla míchána 4 hodiny za teploty místnosti. Potom byl přidán dimethylsulfát (5,6 g, 45 mmol) a směs byla míchána 8 hodin za teploty místnosti. Směs byla vlita do vody, vyloučená látka byla odsáta a promyta vodou. Surový produkt byl čištěn vakuovou sublimací. Bylo získáno 8,0 g látky (76 %) o t.t. 128 až 133 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

4-chlor-6-methoxy-3-methyl-1H-pyrazolo[3,4-b]chinolin a jeho N¹-methylderivát obecného vzorce I



(I),

kde R je atom vodíku nebo methylskupina.