

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

268 890

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁴

C 07 C 57/62

(21) PV 7624-88.L

(22) Přihlášeno 21 11 88

(40) Zveřejněno 14 08 89

(45) Vydáno 31 10 90

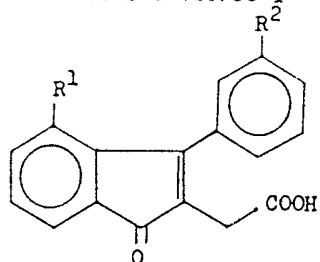
(75)

Autor vynálezu ŠANTRŮČEK MILAN,
KŘEPELKA JIŘÍ ing. CSc., PRAHA

(54)

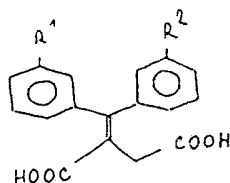
Halogenderiváty kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-
-2-yl octové a způsob jejich přípravy

(57) Řešení se týká nových halogenderi-
vátů kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-2-yl
octové obecného vzorce I



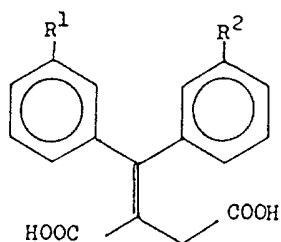
(I),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor
nebo R^1 i R^2 brom, v prostředí mine-
rální kyseliny, výhodně kyseliny síro-
vé při 0 °C.

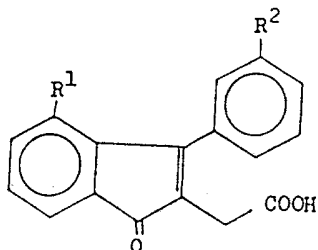


(II),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor ne-
bo R^1 i R^2 brom, sloužících jako mezi-
stupeň přípravy antineoplasticky účin-
ných halogenderivátů benzo(c)fluorenu.
Jejich příprava spočívá v cyklizaci
odpovídajících halogenovaných difenyli-
takových kyselin obecného vzorce II



Vynález se týká nových halogenderivátů kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-2-yl octové obecného vzorce I

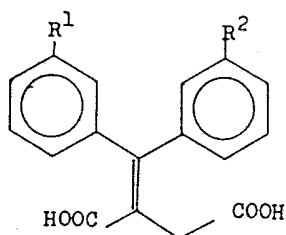


(I),

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 s pol. 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 halogenovaných difenylitakonových kyselin obecného vzorce II



(II),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom, čs. autorské osvědčení č. 268889 cyklizací v prostředí minerální kyseliny, výhodně kyseliny sírové, při 0 °C.

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

Příklad

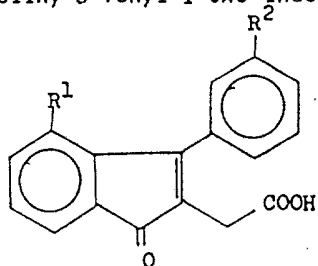
Kyselina 3-(3-bromfenyl)-5-brom-1-oxo-inden-2-yl octová

Za chlazení ledem bylo do tříhrdlé baňky opatřené zpětným chladičem a míchadlem vneseno 14 g (0,032 mol) kyseliny 3,3'-dibrom-difenylitakonové do 22,4 ml (0,41 mol) koncentrované kyseliny sírové. Černý roztok byl za chlazení míchán 3 hodiny. Poté byla reakční směs vlita do kádinky s ledem a míchána až do jeho rozpuštění. Vzniklá žlutá sraženina byla odsáta a promyta vodou. Nato byla sraženina převedena do Erlenmeyerovy baňky a přidáno 130 ml vody a 3 g (0,075 mol) hydroxidu sodného a směs zahřívána do vytvoření homogenního roztoku, který byl za horka zfiltrován a okyselen koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou na pH = 3. Vyloučená žlutá sraženina byla odsáta a sušena volně na vzduchu. Rekrystalizací z ethanolu byla získána látka o teplotě tání 107 až 110 °C. Bylo získáno 11,8 g (88,6 %) produktu).

Analogicky byla připravena kyselina 3-(3-chlorfenyl)-1-oxo-inden-2-yl octová, T.t = 102 až 104 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

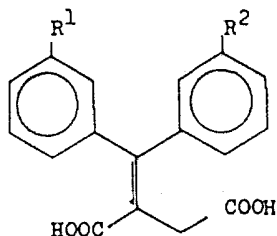
1. Halogenderiváty kyseliny 3-fenyl-1-oxo-inden-2-yl octové obecného vzorce I



(I),

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

2. Kyselina 3-(3-bromfenyl)-5-brom-1-oxo-inden-2-yl octová.
3. Kyselina 3-(3-chlorfenyl)-1-oxo-inden-2-yl octová.
4. Způsob přípravy látek podle bodu 1 obecného vzorce I, vyznačující se tím, že odpovídající halogenované kyseliny difenylitakonové obecného vzorce II



(II),

ve kterém R^1 značí vodík a R^2 chlor nebo R^1 i R^2 brom, se cyklizují v prostředí minerální kyseliny, s výhodou kyseliny sírové, při 0 °C.