

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(18)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

235196
(11) (B1)

(51) Int. Cl.³
C 07 D 471/04

(22) Přihlášeno 15 11 83

(21) [PV 1307-84]

(40) Zveřejněno 17 09 84

(45) Vydáno 15 02 87

(75)

Autor vynálezu

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

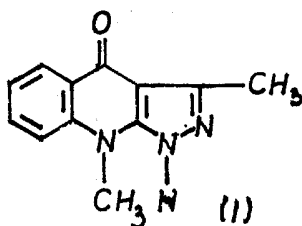
(54) Způsob přípravy 4,9-dihydro-3,9-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo(3,4-b)-chinolinu

1

Vynález se týká nového způsobu přípravy 4,9-dihydro-3,9-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo-(3,4-b)chinolinu, vyznačujícího se tím, že se zahřívá 4,9-dihydro-2,3,9-trimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo[3,4-b]chinolin s hydrochloridem pyridinu na teplotu 200 až 240 °C, výhodně na teplotu 220 °C.

2

Vynález se týká nového způsobu přípravy 4,9-dihydro-3,9-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo[3,4-b]chinolinu vzorce I



Uvedená sloučenina vzorce I slouží jako meziprodukt pro přípravu biologicky významných látek, zejména s protivirovým účinkem.

Uvedená sloučenina vzorce I je známá látka, je popsána její příprava, vyznačující se tím, že se zahřívá 4-(2-fluorfenyl)-6,3-dihydro-1,3,8-trimethylpyrazolo[3,4-e]([1,4]diazepin-7(1H)on s hydrochloridem pyridinu na teplotu 210 až 215 °C [DeWald H. A.; J. Heterocyclic Chem. 11, 1061 (1974)].

Uvedená sloučenina vzorce I byla připravena způsobem podle vynálezu, vyznačující se tím, že se zahřívá 4,9-dihydro-2,3,9-trimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo[3,4-b]chinolin (čs. autorské osvědčení č. 235 168 s hydrochloridem pyridinu při teplotě 200 až 240 °C, výhodně při teplotě 220 °C.

Vzhledem ke snadné připravitelnosti výchozího 4,9-dihydro-2,3,9-trimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo[3,4-b]chinolinu (čs. autorské osvědčení č. 235 168), a vzhledem k obtížné přípravě 4-(2-fluorfenyl)-6,8-dihydro-1,3,8-trimethylpyrazolo[3,4-e]([1,4]diazepin-7(1H)onu, je zřejmá výhodnost přípravy sloučeniny vzorce I podle vynálezu.

Následující příklad provedení vynález dokládá, ale nikterak neomezuje.

Příklad

4,9-Dihydro-3,9-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo[3,4-b]chinolin

Z míchané směsi 30 g pyridinu a 44 ml koncentrované kyseliny chlorovodíkové byla postupným zvyšováním teploty na 160 °C oddestilována voda. Při této teplotě bylo přidáno 3,2 g 4,9-dihydro-2,3,9-trimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo[3,4-b]chinolinu a směs byla míchána 2 hodiny při teplotě 220 °C. Po ochlazení na 160 °C byla směs nalita do 240 ml vody, směs byla povařena a nerozpustný podíl byl odfiltrován. Látka vyloučená po ochlazení filtrátu byla odsáta a promyta vodou. Krystaly získané krystalizací z ethanolu byly sušeny do konstantní hmotnosti při teplotě 110 °C za tlaku 3 kPa. Bylo získáno 2,32 g látky (77,7 %) o t. t. 248,8 až 249,5 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Způsob přípravy 4,9-dihydro-3,9-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo[3,4-b]chinolinu, vyznačující se tím, že se zahřívá 4,9-dihydro-2,3,9-

-trimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo[3,4-b]chinolin s hydrochloridem pyridinu při teplotě 200 až 240 °C, výhodně při teplotě 220 °C.