



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

252342

(11) (B1)

(51) Int. Cl.⁴
C 07 D 471/04

(22) Přihlášeno 08 05 86

(21) PV 3353-86

(40) Zveřejněno 15 01 87

(45) Vydáno 16 05 88

(75)

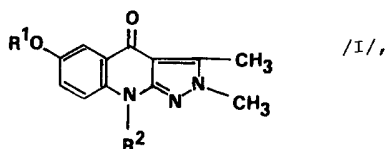
Autor vynálezu

ZIKÁN VIKTOR ing. CSc.,

RÁDL STANISLAV ing. CSc., PRAHA

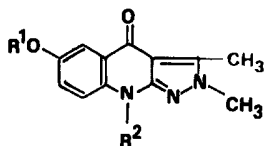
(54) O,N-substituované 4,9-dihydro-6-hydroxy-2,3-dimethyl-4-oxo-2H-pyrazolo(3,4-b)chinoliny

Řešení se týká O,N-substituovaných
4,9-dihydro-6-hydroxy-2,3-dimethyl-4-oxo-
-2H-pyrazolo(3,4-b) chinolinů obecného
vzorce I



kde R¹ a R² je atom vodíku nebo metylskupi-
na. Tyto nové, dosud nepopsané látky, jsou
použitelné jako meziproducty pro přípravu
látek vykazujících významné biologické
účinky, zejména protivirový a proti-
nádorový účinek.

Vynález se týká O,N-substituovaných 4,9-dihydro-6-hydroxy-2,3-dimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolinů obecného vzorce I



/I/,

kde R^1 a R^2 je atom vodíku nebo metylskupina.

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

Sloučeninu obecného vzorce I, kde R^1 je metylskupina a R^2 je atom vodíku, lze podle vynálezu připravit cyklizací o sobě známé 3-/4-methoxyanilino/-1,5-dimetyl-1H-pyrazol-4-karboxylové kyseliny polyfosforečnou kyselinou za zvýšené teploty. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R^1 i R^2 je metylskupina, lze podle vynálezu připravit metylací sodné soli 4,9-dihydro-6-methoxy-2,3-dimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolinu metyljodidem, výhodně za teploty místnosti v dimetylformamidu. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R^1 je atom vodíku a R^2 je metylskupina, lze podle vynálezu připravit z 4,9-dihydro-6-methoxy-2,3,9-trimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolinu demethylací azeotropickou bromovodíkovou kyselinou.

Způsob přípravy látek je jednoduchý a poskytuje látky v uspokojivých výtěžcích. Získané produkty jsou přímo použitelné k dalšímu zpracování. Blížší 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-2,3-dimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolin

Směs 3-/4-methoxyanilino/-1,5-dimetyl-1H-pyrazol-4-karboxylové kyseliny /13,1 g, 50 mmol/ a polyfosforečné kyseliny /75 g, 85 % P_2O_5 / byla míchána 4 hodiny při teplotě 90 °C. Po přidání /500 ml/ byla směs ochlazená, nerozpustný podíl byl odsát a překrystalován z 50% vodného dimetylformamidu. Bylo získáno 9,6 g látky /79 %/ netající do 360 °C.

P ř í k l a d 2

4,9-Dihydro-6-methoxy-2,3,9-trimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolin

K míchané suspenzi 4,9-dihydro-6-methoxy-2,3-dimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/ chinolinu /12,2 g, 50 mmol/ v dimetylformamidu /200 ml/ byl přidán 80% hydrid sodný /1,8 g, 60 mmol/ a směs byla míchána 1 hodinu za teploty místnosti. Po přidání metyljodidu /8,5 g 60 mmol/ byla směs míchána 8 hodin za teploty místnosti. Po přidání vody /250 ml/ byla směs ochlazená, nerozpustný podíl byl odsát a krystalován z etanolu. Bylo získáno 12,1 g látky /94 %/ o t.t. 191 až 193 °C.

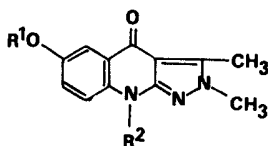
P ř í k l a d 3

4,9-Dihydro-6-hydroxy-2,3,9-trimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/chinolin

Směs 4,9-dihydro-6-methoxy-2,3,9-trimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/chinolinu /5,1 g, 20 mmol/ a azetropické bromovodíkové kyseliny /70 ml/ byla vařena 5 hodin pod zpětným chladičem. Nerozpustný podíl vyloučený po ochlazení byl odsát a krystalizován z etanolu. Bylo získáno 3,9 g látky /79 %/ netající do 360 °C.

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

O,N-Substituované 4,9-dihydro-6-hydroxy-2,3-dimetyl-4-oxo-2H-pyrazolo/3,4-b/chinoliny obecného vzorce I



/I/,

kde R¹ a R² je atom vodíku nebo metylskupina.