



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVEDČENÍU

211 852

(11)

(B1)

(61)

(23) Výstavná priorita
(22) Prihlášené 06 04 79
(21) PV 2885-80

(51) Int. Cl.³

C 07 D 491/147
// C 07 D 223/16
A 61 K 31/33

(40) Zverejnené 31 07 81
(45) Vydané 01 12 83

(75)

Autor vynálezu

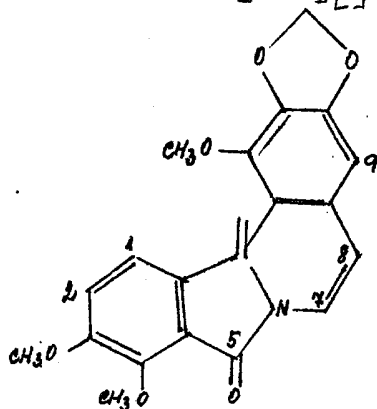
PROKSA BOHUMIL ing.CSc., HLOHOVEC
VOTICKÝ ZDENO dr.ing.CSc.
FUSKA JÁN ing.CSc., BRATISLAVA

(54)

Derivát 5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ónu

1

Vynález sa týka derivátu 5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ónu vzorca I;



(I)

vynález sa tiež týka spôsobu výroby derivátu vzorca I.

Látka vzorca I, ktorá doteraz nebola opísaná, je cennou, farmakologicky významnou látkou s potenciálnymi cytotoxickými vlastnosťami.

Zlúčeniny základného skeletu 7,8-dihydro-5H-izoindolo-[1,2-b][3]benzazepin-5-ónu boli získané napr. oxidáciou papaverrubínu A (Walterová, Šantavý, Coll.Czech.Chem.Comm. 33, 1623, 1968), izoláciou zo zmesi vedľajších opiových alkaloidov (Trojánek a sp. Coll.Czech.Chem.Comm. 40, 681, 1975), alebo syntézou vychádzajúcou z narkotínu (Teitel a sp. Can.J.Chem. 50, 2022, 1972). Látky uvedeného základného skeletu, ale s dvojitou väzbou v polohe 7+8 sa doteraz nepo-

darilo pripraviť.

Pri spôsobe výroby látky vzorca I sa postupuje tak, že sa najprv 7,8-dihydro-3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ón prevádza účinkom metyljodidu na jódmetylát, ktorý sa potom rozkladá účinkom roztoku hydroxidu draselného.

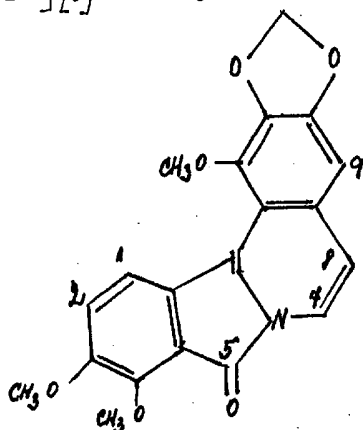
Bližšie podrobnosti vyplývajú z príkladu prevedenia.

Príklad prevedenia

3,4,12-trimetoxy-10,11-metyléndioxy-5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ón
K roztoku 25 mg 7,8-dihydro-3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-5H-izoindolo 1,2-b 3 benzazepin-5-ónu v 10 ml chloroformu sa pridá 50 ml metyljodinu, zmes sa refluxuje 2 hodiny, rozpúšťadlo sa odparí a suchý odparok sa zmieša s 5 ml 30 %-ného roztoku hydroxidu draselného. Suspezia sa zahrieva 3 hodiny, pevná fáza sa odfiltruje a kryštalizuje z acetónu. Získa sa 18 mg žiadanej látky vo forme červených kryštálov, s t.t. 254-255 °C.

P R E D M E T V Y N Á L E Z U

1. Derivát 5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ónu vzorca I



2. Spôsob výroby derivátu 5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ónu vzorca I, podľa bodu 1, vyznačujúci sa tým, že sa najprv 7,8-dihydro-3,4,12-trimetoxy-7-dimetylamino-10,11-metyléndioxy-5H-izoindolo[1,2-b][3]benzazepin-5-ón prevádza posobením metyljodidu na jódmetylát, ktorý sa potom rozkladá účinkom roztoku hydroxidu draselného.