

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

235182

(11)

(B1)

(51) Int. Cl.⁵
C 07 D 471/04

(22) Přihlášeno 09 09 83
(21) (PV 8459-83)

(40) Zveřejněno 17 09 84

(45) Vydáno 15 02 87

(75)

Autor vynálezu

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

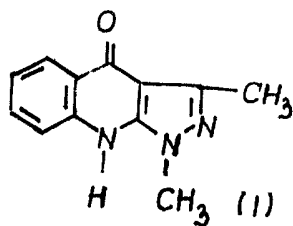
(54) Způsob přípravy 4,9-dihydro-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo(3,4-b)-chinolinu

1

2

Vynález se týká nového způsobu přípravy 4,9-dihydro-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo-(3,4-b)chinolinu, vyznačujícího se tím, že se hydrolyzuje 4-chlor-1,3-dimethyl-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolin varem s kyselinou chlorovodíkovou.

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



Uvedená sloučenina vzorce I slouží jako meziproduct pro přípravu biologicky významných látek, zejména s protivirovým účinkem podle čs. autorského osvědčení číslo 235 167.

Uvedená sloučenina vzorce I je známá látka, je popsána její příprava z N-(1,3-dimethyl-5-pyrazolyl)anthranilové kyseliny [Stein R. G., Biel J. H.: Med. Chem. 13, 153 (1973)], nebo z 5-amino-4-(2-fluorbenzoyl)-1,3-dimethylpyrazolu [DeWald H. A.: J. Heterocyclic Chem. 11, 1061 (1974)].

Uvedená sloučenina vzorce I byla připravena způsobem podle vynálezu, vyznačující se tím, že se obecně známý 4-chlor-1,3-dimethyl-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolin [Stein R. G., Biel J. H.: J. Med. Chem. 13, 153 (1973)] hydrolyzuje varem s 0,1M až 5M roztokem kyseliny chlorovodíkové, s výhodou s 1M kyselinou chlorovodíkovou.

Následující příklad provedení vynález dokládá, ale nikterak neomezuje.

Příklad

4,9-dihydro-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolin

Směs 2,32 g 4-chlor-1,3-dimethyl-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolinu (10 mmol) a 23 ml 1M kyseliny chlorovodíkové byla 2 hodiny vařena pod zpětným chladičem. Po ochlazení reakční směsi byl přidán vodný amoniak do dosažení pH 8 a poté byla směs zneutralizována kyselinou octovou. Nerozpustný podíl byl odsát, promyt vodou a překrystalován z acetonu. Bylo získáno 1,73 g látky (81,1 %) o t. t. 334 °C až 336 °C.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Způsob přípravy 4,9-dihydro-1,3-dimethyl-4-oxo-1H-pyrazolo(3,4-b)chinolinu, vyznačující se tím, že se 4-chlor-1,3-dimethyl-1H-py-

razolo(3,4-b)chinolin hydrolyzuje varem s 0,1 M až 5 M kyselinou chlorovodíkovou, výhodně s 1 M kyselinou chlorovodíkovou.