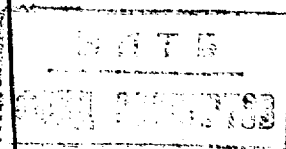




Государственный комитет
СССР
по делам изобретений
и открытий

О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(11) 728718



(61) Дополнительный к патенту -

(22) Заявлено 10.11.78 (21) 2582299/
2683104/23-04

(23) Приоритет - (32) 25.02.77

(31) Р 2708121.6 (33) ФРГ

Опубликовано 150480. Бюллетень № 14

Дата опубликования описания 150480

(51) М. Кл.²

С 07 D 495/14//
А 61 К 31/55

(53) УДК 547.892.07
(008.8)

(72) Авторы
изобретения

Иностранцы
Карл-Хайнц Вебер, Адольф Лангбайн, Эрих Лер, Карин Беке
и Франц Йозеф Кун
(ФРГ)

(71) Заявитель

Иностранная фирма
'К.Х.Берингер Зон'
(ФРГ)

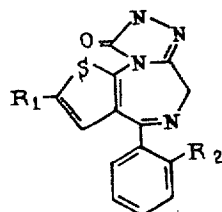
(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ ТРИАЗОЛОТИЕНОДИАЗЕПИН-1-ОНОВ

1

Изобретение относится к способу получения новых производных триазолотиенодiazепин-1-онов, обладающих ценными фармакологическими свойствами.

Цель изобретения - получение новых полезных соединений, расширяющих арсенал средств воздействия на живой организм - достигается путем синтеза последних, основанного на известной реакции взаимодействия производных 2-гидразино-3Н(2,3-е)-тиено-1,4,-дiazепина с фосгеном [1].

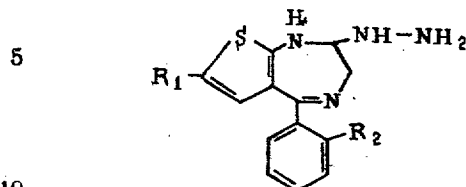
Описывается, согласно изобретению, способ получения триазолотиенодiazепин-1-онов общей формулы I



где R₁ - атом хлора, брома или йода,
R₂ - водород или галоид.

2

путем взаимодействия 2-гидразинотиенодiazепина общей формулы II



где R₁ и R₂ имеют указанные значения, с фосгеном. Целевой продукт выделяют известными приемами.

Обычно способ осуществляют следующим образом: соединение гидразина II растворяют в инертном растворителе, например в толуоле, ксилоле, бензоле или хлористом углеводороде и подвергают взаимодействию с раствором фосгена в том же самом растворителе или с газообразным фосгеном при температуре между 0°C и точкой кипения реакционной смеси. При этом фосген целесообразно добавлять при комнатной температуре и затем смесь постепенно нагревать до точки кипения.

Соединения общей формулы II известны и могут быть получены путем взаимодействия соответствующего 2-меркаптотиенодiazепина с гидразином.

Пример 1. 8-Бром-6-(о-хлорфенил)-4Н-S-триазоло(3,4-с)тиено-(2,3-е)-1,4-дiazепин-1-он.

11 г (0,03 моля) 7-бром-5-(о-хлорфенил)-2-гидразино-3Н-[2,3-е]тиено-1,4-дiazепина растворяют в 250 мл толуола и затем смешивают со 100 мл 15%-ного раствора фосгена в толуоле. После одночасового размешивания при комнатной температуре и двухчасового размешивания при температуре кипения реакционный раствор после охлаждения встряхивают с насыщенным раствором карбоната натрия. Органическую фазу после сушки упаривают и после перекристаллизации из метанола получают 0,1 г (77% от теоретического) целевого соединения с т.пл. 233-235°C.

Аналогично приведенному в примерах 1 способу получают следующие соединения:

8-Хлор-6-(о-хлорфенил)-4Н-S-триазоло-(3,4-с)тиено[2,3-е]-1,4-дiazепин-1-он; т.пл. 219-222°C

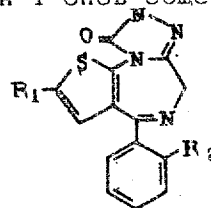
8-Бром-6-(о-бромфенил)-4Н-S-триазоло-[3,4-с]тиено(2,3-е)-1,4-дiazепин-1-он, т.пл. 212-214°C

8-Иод-6-(о-хлорфенил)-4Н-S-триазоло-(3,4-с)тиено(2,3-е)-1,4-дiazепин-1-он, т.пл. 215-217°C

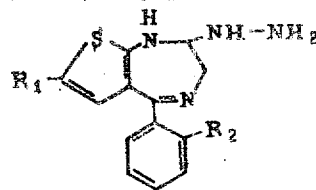
8-Хлор-6-фенил-4Н-S-триазоло-(3,4-с)тиено(2,3-е)-1,4-дiazепин-1-он, т.пл. 170-172°C

Формула изобретения

Способ получения триазолотиено-дiazепин-1-онов общей формулы I



где R₁ — атом хлора, брома или йода, R₂ — водород или галогид, отличающийся тем, что соединение общей формулы II



в которой R₁ и R₂ имеют указанные значения, подвергают взаимодействию с фосгеном.

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе
1. Патент Великобритании №1346016, кл. С 07 d 99/06, опублик. 1974.

Составитель Г. Коннова
Редактор Л. Емельянова Техред Н. Бабурка Корректор Н. Стец

Заказ 1170/54 Тираж 495 Подписное

ЦНИИПИ Государственного комитета СССР
по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Филиал ППП "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4