



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) UA

(11) 85092

(13) U

(51) МПК

C07D 417/14 (2006.01)

## (12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2013 05899**

(22) Дата подання заявки: **13.05.2013**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **11.11.2013**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **11.11.2013, Бюл.№ 21**

(72) Винахідник(и):

**Доценко Віктор Вікторович (UA),  
Кривоколіско Сергій Геннадійович (UA)**

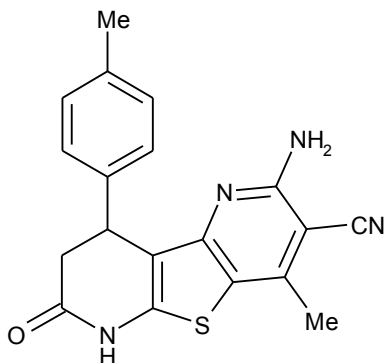
(73) Власник(и):

**СХІДНОУКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ  
УНІВЕРСИТЕТ ІМЕНІ ВОЛОДИМИРА  
ДАЛЯ,  
квартал Молодіжний, 20-а, м. Луганськ,  
91034 (UA)**

(54) **2-АМІНО-4-МЕТИЛ-7-ОКСО-9-(п-ТОЛІЛ)-3-ЦІАНО-6,7,8,9-ТЕТРАГІДРОПІРИДО[3',2':4,5]ТІЕНО[3,2-  
b]ПІРИДИН**

(57) Реферат:

2-Аміно-4-метил-7-оксо-9-(п-толil)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіридо[3',2':4,5]тієно[3,2-b]піридин  
формули (I)



(I)

UA 85092 U



Корисна модель належить до галузі органічного синтезу, а саме до нових частково гідрованих заміщених піридотієнопіридинів, які можуть знайти своє застосування як сполуки з направленою фармацевтичною дією або "будівельні блоки" для отримання нових цінних органічних сполук.

Найбільш близькими до сполуки, що заявляється, є дигідропіридотієнопіридини - похідні заміщених 1,4-дигідро-3-ціанопіридин-2-тіолатів піперидинію та 2-бром-1-(4-бромфеніл)етиліденмалононітрилу [Артемов В.А., Иванов В.Л., Родиновская Л.А., Шестопалов А.М., Литвинов В.П., Химия гетероцикл. соединений, 1996, 553 [Chem. Heterocycl. Compd., 1996, (Engl. Transl.)]].

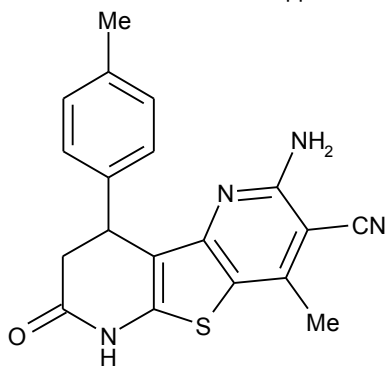
Спільною суттєвою ознакою прототипу та корисної моделі, що заявляється, є те, що ці сполуки належать до групи похідних частково гідрованих піридотієнопіридинів.

В основу корисної моделі поставлена задача замість 1,4-дигідропіридинового кільця тетрагідропіридоновий цикл, у четвертому положенні цієї сполуки замість 4-фенільного замісника знаходиться метильна група, а у восьмому положенні замісник взагалі відсутній.

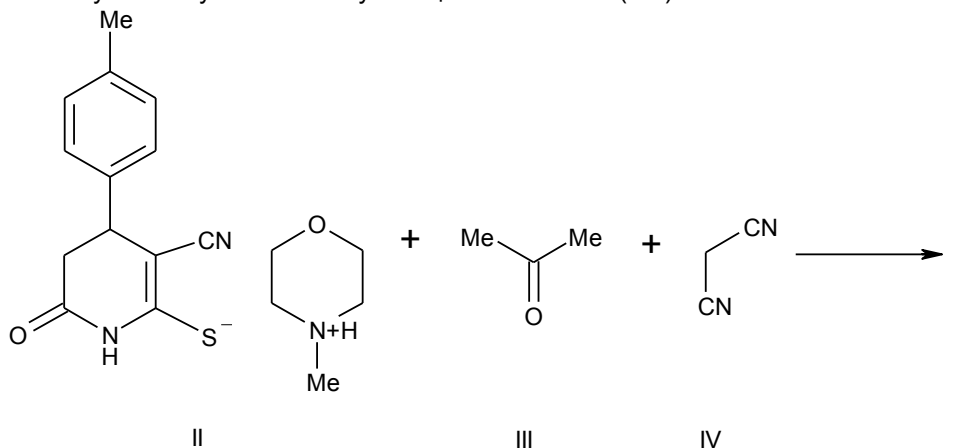
Поставлена задача вирішується тим, що створення нового похідного частково гідрованих піридотієнопіридинів.

У відповідності до цього в корисній моделі пропонується нова сполука - 2-аміно-4-метил-7-оксо-9-(*n*-толіл)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіридо[3',2':4,5]тієно[3,2-*b*]піридин формули (I).

Сполука (I) та способи її отримання в патентних виданнях не описані.



Синтез 2-аміно-4-метил-7-оксо-9-(*n*-толіл)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіридо[3',2':4,5]тієно[3,2-*b*]піридину (I) здійснюють наступним чином: суміш 8.2 ммоль тетрагідропіридинтіолату (II), 82 ммоль ацетону (III), 12.3 ммоль малононітрилу (IV) в 35 мл етанолу кип'ятять при перемішуванні 20 годин, після чого залишають на 48 годин при кімнатній температурі. Осад, що утворився, відфільтровують, послідовно промивають етанолом та гексаном. Продукт реакції (I) перекристалізують із суміші етанолу та оцтової кислоти (1:3).



Структура сполуки, що заявляється, підтверджується спектрами ЯМР  $^1\text{H}$ , знятими на приладі "Bruker Avance II 400" (399.97 МГц) в ДМСО- $d_6$  (внутрішній стандарт - ТМС), ІЧ-спектри отримували на спектрофотометрі "ИК-29" у вазеліновій олії. Елементний аналіз проводили на приладі "Perkin-Elmer C, H, N-Analyzer". Контроль індивідуальності синтезованих сполук проводили методом ТШХ на пластинках "Silufol UV-254", у системі ацетон-гептан (1:1), проявлення пари йоду, ІЧ-детектор.

Одержаний продукт має достатню чистоту для аналізу та для подальшого використання.

Таким чином, 2-аміно-4-метил-7-оксо-9-(п-толіл)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіrido[3',2':4,5]тієно[3,2-b]піридин (I) за структурними та фізико-хімічними властивостями суттєво відрізняється від сполук порівняння.

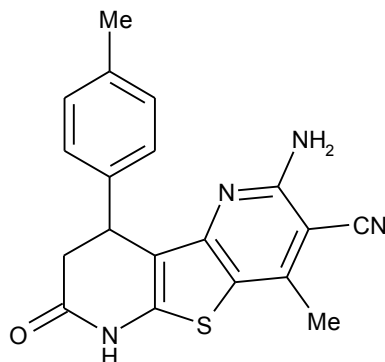
Корисна модель підтверджується наступним прикладом, який ілюструє, але не обмежує його об'єм.

Приклад. 2-Аміно-4-метил-7-оксо-9-(п-толіл)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіrido[3',2':4,5]тієно[3,2-b]піридин (I). Вихід 34 %. Т. пл. 288-290 °С, кристали світло-жовтого кольору. Знайдено, %: С, 65.02; Н, 4.70; N, 16.24.  $C_{19}H_{16}N_4OS$ . Вираховано, %: С, 65.50; Н, 4.63; N, 16.08. ІЧ-спектр,  $\nu$ ,  $cm^{-1}$  (вазелинова олія): 3465, 3280, 3200 (NH,  $NH_2$ ); 2201 (CN); 1689 (C=O). Спектр ЯМР  $^1H$ ,  $\delta$ , м.д.: 2.19 (с, 3 H,  $Me_{арил}$ ); 2.43 (с, 3 H, C(4)Me); 2.68 та 3.00 (обидва розш. псевдод., по 1 H, C(8)H $_2$ ,  $^2J=16.0$ )\*; 4.41 (розш. псевдод., 1 H, C(9)H)\*; 6.06 (розш. с, 2 H,  $NH_2$ ); 6.96 (розш. с, 4 H, Ar); 10.91 (розш. с, 1 H, NH).

\*Дублет дублетів проявляється у вигляді розширеного псевдодублету внаслідок накладання сигналів.

#### ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

2-Аміно-4-метил-7-оксо-9-(п-толіл)-3-ціано-6,7,8,9-тетрагідропіrido[3',2':4,5]тієно[3,2-b]піридин формули (I)



(I)

20

---

Комп'ютерна верстка І. Мироненко

---

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

---

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601