



ДЕРЖАВНА СЛУЖБА  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ  
УКРАЇНИ

УКРАЇНА

(19) **UA**

(11) **80819**

(13) **U**

(51) МПК

**C07D 409/14** (2006.01)

## (12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА КОРИСНУ МОДЕЛЬ

(21) Номер заявки: **u 2012 14942**

(22) Дата подання заявки: **26.12.2012**

(24) Дата, з якої є чинними  
права на корисну  
модель: **10.06.2013**

(46) Публікація відомостей  
про видачу патенту: **10.06.2013, Бюл.№ 11**

(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) **2,4-ДІАМІНО-5-ІМІНО-10-(4-МЕТОКСИФЕНІЛ)-8-ОКСО-3-ЦІАНО-7,8,9,10-ТЕТРАГІДРО-5Н-ПІРИДО[2,'3':2,3]ТІОПІРАНО[4,5-b]ПІРИДИН**

(57) Реферат:

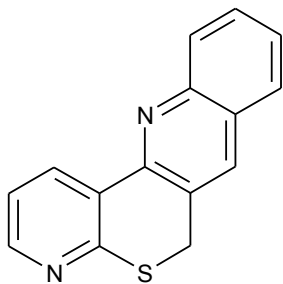
2,4-Діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5Н-піридо[2',3':2,3]тіопірано[4,5-b]піридин.

**UA 80819 U**

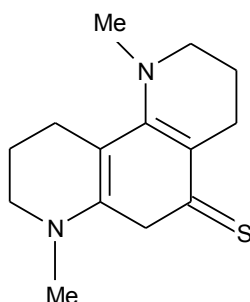


Корисна модель належить до галузі органічного синтезу, а саме до нових частково гідрованих піридотіопіранопіридинів, які можуть знайти своє застосування як сполуки з направленою фармацевтичною дією або "будівельні блоки" для отримання нових цінних органічних сполук.

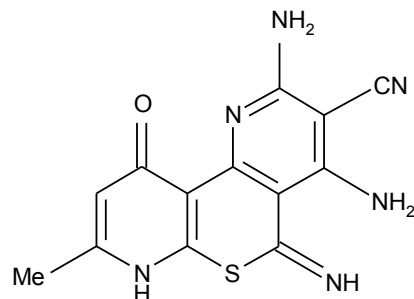
- 5 Найбільш близькими до сполуки, що заявляється, є похідні 6H-піrido[3',2':5,6]тіопірано[4,3-b]хіноліну (I) [Settimo A.D., Marini A.M., Primofiore G., Settimo F.D., Salemo S., Simorini F., Pardi G., Motto C.L., Bertini D., Journal of Heterocyclic Chemistry, 2002, vol. 39, # 5, p. 1001-1006] та 1,5-діаза-1,5-диметил-10-тіа-1,2,3,4,5,6,7,8-октагідро-10H-фенантрен-9-тіон (II) [Gompper R., Elser W., Angewandte Chemie, 1967, vol. 79, p.382-383], але прототипом її можна вважати 2,4-діаміно-5-іміно-8-метил-10-оксо-3-ціано-7,10-дигідро-5H-піrido[2',3': 4,5]тіопірано[2,3-b]піридин (III) [Dotsenko V.V., Krivokolysko S.G., Litvinov V.P., Chernega A.N., Chemistry of Heterocyclic Compounds, 2007, vol. 43, # 5, p. 599-607].



I



II



III

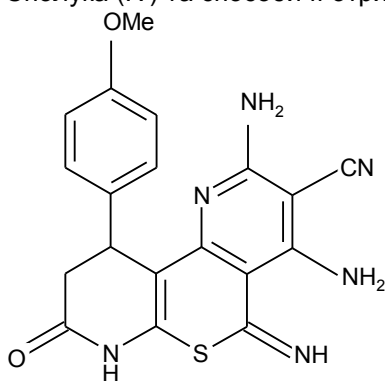
- 15 Спільною суттєвою ознакою вказаних сполук та корисної моделі є те, що ці сполуки належать до малочисельної групи похідних піридотіопіранопіридинів.

Корисна модель, на відміну від найближчого аналога, містить у своєму складі замість дигідропіридинового кільця тетрагідропіридиновий цикл, у восьмому положенні - оксогрупу, в десятому - 4-метоксифенільний замісник.

Задачею корисної моделі є створення нового похідного піридотіопіранопіридинів.

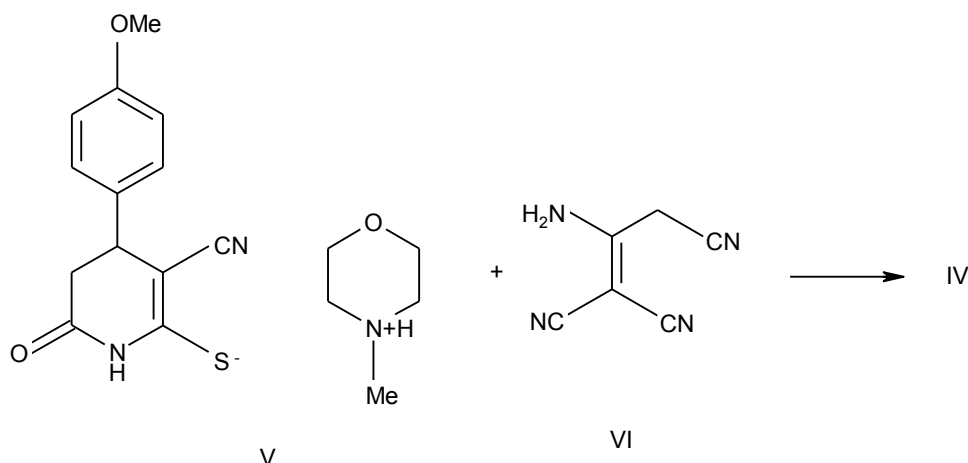
- 20 Поставлена задача вирішується тим, що пропонується нова сполука - 2,4-діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5H-піrido[2',3': 2,3]тіопірано[4,5-b]піридин формули (IV).

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



(IV)

- 25 Синтез 2,4-діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5H-піrido[2',3': 2,3]тіопірано[4,5-b]піридину (IV) здійснюють наступним чином: суміш 9 ммоль тетрагідропіридинтіолату (V) та 13.5 ммоль 2-аміно-1,1,3-триціанопропену (VI) в 35 мл етанолу кип'ятять 15 годин, осад, що утворився, відфільтровують та перекристалізують з суміші оцтової кислоти та диметилформаміду (1:1)



Структура сполуки, що заявляється, підтверджується спектрами ЯМР  $^1\text{H}$ , знятими на приладі "Gemini 200" (200 МГц) в ДМСО- $d_6$  (внутрішній стандарт -ТМС), ІЧ-спектри отримували на спектрофотометрі "ІКС-29" у вазеліновій олії. Елементний аналіз проводили на приладі "Perkin-Elmer C, H, N-Analyzer". Контроль індивідуальності синтезованої сполуки 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.

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

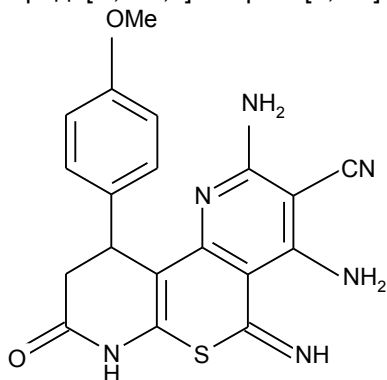
Приклад.

2,4-Діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5Н-піридо[2',3':2,3]тіопірано[4,5-*b*]піридин (IV). Вихід 41 %. Т. плавл. 288-291 °С, кристали темно-жовтого кольору. Знайдено, %: С, 58.34; Н, 4.15; N, 21.64.  $\text{C}_{19}\text{H}_{16}\text{N}_6\text{O}_2\text{S}$ . Вирахувано, %: С, 58.15; Н, 4.11; N, 21.41. ІЧ-спектр,  $\nu$ ,  $\text{cm}^{-1}$  (вазелинова олія): 3500, 3435, 3340, 3235 (2 NH, 2  $\text{NH}_2$ ); 2194, 2179пл. (CN); 1684 (C=O). Спектр ЯМР  $^1\text{H}$ ,  $\delta$ , м.д.: 2.57 (розш. псевдод., 1 H, C(9)H,  $^2J=17.3$ )\*; 2.88 (д.д., 1 H, C(9)H,  $^2J=17.3$ ,  $^3J=7.1$ ); 3.70 (с, 3 H, MeO); 4.95 (розш. псевдод., 1 H, C(10)H)\*; 6.31 (розш. с, 2 H, C(2)NH $_2$ ); 6.73 (м, 1 H, C(4)NH $_2$ ; 2 H, Ar); 7.12 (д, 2 H, Ar,  $^3J=7.0$ ); 9.60 (розш. с, 1 H, C(5)NH); 10.34 (с, 1 H, NH); 10.85 (розш. с, 1 H, C(4)NH $_2$ ). \* Дублет дублетів проявляється у вигляді розширеного псевдодублету внаслідок накладання сигналів.

Таким чином, 2,4-діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5Н-трідо[2',3':2,3]тіотрано[4,5-*b*]піридин (IV) за структурними та фізико-хімічними властивостями суттєво відрізняється від сполук порівняння.

## ФОРМУЛА КОРИСНОЇ МОДЕЛІ

2,4-Діаміно-5-іміно-10-(4-метоксифеніл)-8-оксо-3-ціано-7,8,9,10-тетрагідро-5Н-піридо[2',3':2,3]тіопірано[4,5-*b*]піридин формули:



---

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