BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

DEUTSCHES PATENTAMT

PATENTSCHRIFT 1 149 012

DBP 1 149 012
KL. 12p 10/10
INTERNAT. KL. C 07d

ANMELDETAG: 25. MAI 1961
BEKANNTMACHUNG DER ANMELDUNG UND AUSGABE DER AUSLEGESCHRIFT: 22. MAI 1963
AUSGABE DER PATENTSCHRIFT: 2. JANUAR 1964

STIMMT ÜBEREIN MIT AUSLEGESCHRIFT

1 149 012 (B 62615 IV d/12 p)

Verfahren zur Herstellung von 3-Hydroxy-pyrazolo[3,4-d]pyrimidinen

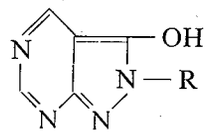
Patentiert für:

Dr. phil. Hellmut Bredereck, Stuttgart

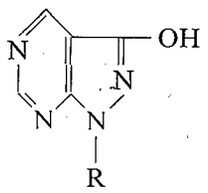
Dr. phil. Hellmut Bredereck, Stuttgart W,
Dr. Franz Effenberger, Stuttgart N,
und Dipl.-Chem. W. Resemann,
Stuttgart-Bad Cannstatt,
sind als Erfinder genannt worden

1

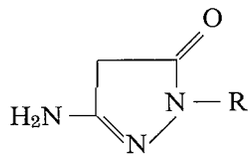
Es wurde gefunden, daß man 3-Hydroxyl-pyrazolo[3,4-d]pyrimidine der allgemeinen Formeln



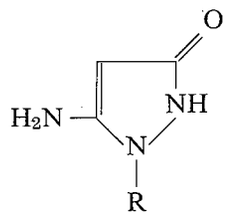
und



worin R eine Alkyl- oder Arylgruppe bedeutet, dadurch gewinnt, daß man ein 3-Amino-pyrazolon-(5) der allgemeinen Formel



bzw.



bei erhöhter Temperatur entweder mit Formamid oder mit Formamidin oder in Gegenwart einer Säure mit Tris-(formylamino)-methan umsetzt.

Pyrazolo[3,4-d]pyrimidine sind pharmakologisch wirksam und können als Arzneimittel Verwendung finden.

Beispiel 1

54 g 1-Phenyl-3-amino-pyrazolon-(5), 75 g Tris-(formylamino)-methan und 2 g p-Toluolsulfonsäure werden in 200 ccm Dimethylformamid 3 Stunden bei 160°C im Ölbad erhitzt. Nach 45stündigem Stehen des erkalteten Reaktionsgemisches erhält man durch Absaugen und Waschen des Rückstandes mit Aceton

2

2-Phenyl-3-hydroxy-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin in orangeroten Kristallen; F. 300°C (Zersetzung). Durch Einengen des Filtrates isoliert man weitere Substanz. Gesamtausbeute: 70 bis 80% der Theorie; F. 320°C (Zersetzung).

Beispiel 2

28 g 1-Phenyl-3-amino-pyrazolon-(5) werden in 100 ccm Formamid 20 Minuten unter Rückfluß erhitzt. Man isoliert nach Abkühlen des Reaktionsgemisches durch Absaugen des Niederschlags das 2 - Phenyl - 3 - hydroxy - pyrazolo [3,4 - d] pyrimidin; F. 320°C; Ausbeute: 60 bis 70% der Theorie.

Beispiel 3

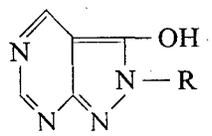
5,2 g 2-Methyl-3-amino-pyrazolon-(5) werden mit 30 ccm Formamid unter Rückfluß 30 Minuten erhitzt. Man isoliert nach Abkühlen des Reaktionsgemisches durch Absaugen des Niederschlages das 1 - Methyl - 3 - hydroxy - pyrazolo [3,4 - d] pyrimidin; F. 276°C; Ausbeute: 50 bis 60% der Theorie.

Beispiel 4

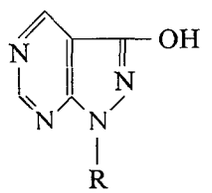
1,0 g 2-Äthyl-3-amino-pyrazolon-(5) wird mit 5 ccm Formamid 30 Minuten unter Rückfluß erhitzt. Man isoliert nach Abkühlen des Reaktionsgemisches durch Absaugen des Niederschlages das 1-Äthyl-3-hydroxy-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin; F. 270°C; Ausbeute: 60% der Theorie.

PATENTANSPRUCH:

Verfahren zur Herstellung von 3-Hydroxypyrazolo[3,4-d]pyrimidinen der allgemeinen Formeln

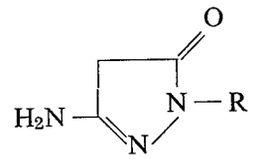


und

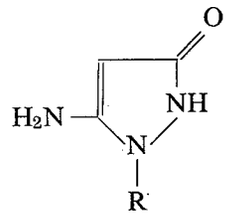


worin R eine Alkyl- oder Arylgruppe bedeutet,

dadurch gekennzeichnet, daß man ein 3-Aminopyrazolon-(5) der allgemeinen Formel



bzw.



bei erhöhter Temperatur entweder mit Formamid oder mit Formamidin oder in Gegenwart einer Säure mit Tris-(formylamino)-methan umsetzt.

309 597/325 5. 63
(309 783/221 12. 63)