

Nitroketenaminale, 10. Mitt.<sup>1)</sup>:

## Synthese von 5-Methyl- und 5-Phenyl-Sulmazol

Nitroketeneaminals, X<sup>1)</sup>: Synthesis of 5-Methyl- and 5-Phenyl-sulmazolReinhard Troschütz\* und Achim Lückel<sup>2)</sup>

Institut für Pharmazie und Lebensmittelchemie der Universität Erlangen-Nürnberg, Schuhstr. 19, D-8520 Erlangen

Eingegangen am 17. März 1992

Hemmstoffe der Phosphodiesterase stellen ein neuartiges Therapieprinzip in der Behandlung der Herzinsuffizienz dar<sup>3)</sup>. Sulmazol (**5c**)<sup>4,5)</sup>, ein Wirkstoff aus dieser Gruppe, wirkt positiv inotrop, indem er die Phosphodiesterase III am Herzen hemmt<sup>6)</sup>. Als Imidazo[4,5-*b*]pyridin mit 2,3-Diamino-Partialstruktur wird **5c** aus 2,3-Diaminopyridin (**1c**) und der Benzoesäure (**3**) aufgebaut<sup>7)</sup>.

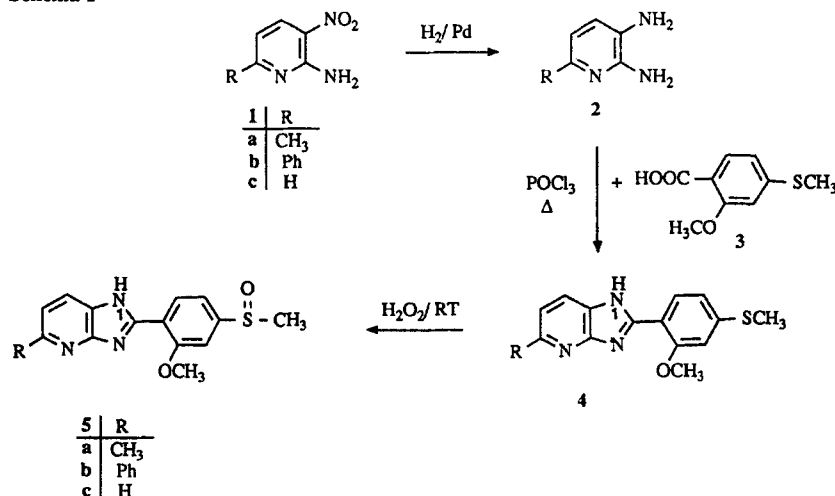
Die Herstellung von im Pyridinring substituierten Derivaten des Sulmazols<sup>8,9,10)</sup>, Verbindungen mit ähnlichem pharmakologischen Wirkprofil, war aufwendig, da die benötigten 2,3-Diaminopyridine nur durch mehrstufige Synthese zugänglich sind<sup>11)</sup>. Dies war für uns Ausgangspunkt, die beiden nach unserer Methode aus 2-Nitroethen-1,1-diamin und den  $\beta$ -Aminovinylketonen 4-Amino-3-buten-2-on und 3-Dimethylamino-1-phenyl-2-propen-1-on gut zugänglichen 2-Amino-3-nitropyridine **1a** bzw. **1b**<sup>12)</sup> für eine Synthese von 5-Methyl- bzw. 5-Phenyl-Sulmazol zu nutzen. Die katalytische Hydrierung der 2-Amino-3-nitropyridine **1a,b** mit Pd/C (10%) bei Raumtemp. in Essigsäureethylester (EE) lieferte in fast quantitativen Ausb. die 2,3-Diaminopyridine **2a,b**. **2a** wurde bereits durch katalytische Hydrierung des 2-Amino-3-nitropyridins

**1a** in EtOH unter Normalbedingungen hergestellt<sup>13)</sup>, wobei die Umsetzung erst nach 24 h abgeschlossen war. Die 2,3-Diaminopyridine **2a,b** wurden nun jeweils in siedendem POCl<sub>3</sub><sup>11)</sup> mit 2-Methoxy-4-(methylthio)benzoesäure (**3**) zu den Imidazo[4,5-*b*]pyridinen **4a,b** umgesetzt. Oxidation der Methylthiogruppe von **4a,b** mit H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> in Eisessig<sup>11)</sup> gab die chiralen Sulfoxide **5a,b**, welche als 5-Methyl- bzw. 5-Phenyl-Analoga des Sulmazols (**5c**) anzusehen sind.

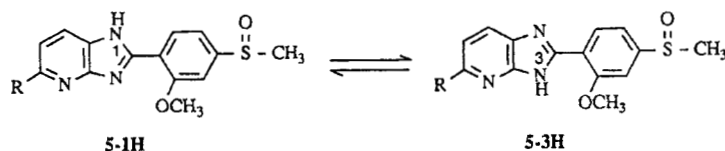
Die Massenspektren und Elementaranalysen von **5a,b** schließen eine zusätzliche Pyridin-*N*-Oxid-Bildung unter den gewählten Reaktionsbedingungen aus. Sehr intensive IR-Absorptionsbanden von **5a** bei 1038 bzw. 1022 cm<sup>-1</sup> und von **5b** bei 1045 cm<sup>-1</sup> bzw. 1026 cm<sup>-1</sup> beweisen die Oxidation zum Sulfoxid<sup>14)</sup>. Im <sup>1</sup>H-NMR-Spektrum ([D<sub>6</sub>]DMSO) von **5a** beträgt der Verschiebungswert für die Methylsulfoxidgruppe  $\delta$  = 2.84 ppm; er ist gegenüber der Methylthiogruppe in **4a** ( $\delta$  = 2.57 ppm) um  $\Delta\delta$  = 0,27 ppm zu tieferem Feld verschoben, was gut mit Literaturdaten übereinstimmt<sup>14)</sup> (entsprechend die <sup>1</sup>H-NMR-Verschiebungswerte von **5b** bei  $\delta$  = 2.85 ppm und von **4b** bei  $\delta$  = 2.59 ppm).

Aufgrund der Tautomerie des Imidazolringes können Imidazo[4,5-*b*]pyridine in der 1*H*- und/oder 3*H*-Form<sup>15)</sup> vorliegen.

Schema 1



Schema 2



Quantenmechanische Berechnungen haben ergeben, daß das 3H-Tautomer einen etwas geringeren Energieinhalt als das 1H-Tautomer besitzt<sup>11)</sup>. Von Barraclough et al.<sup>16)</sup> durchgeführte <sup>1</sup>H-, <sup>13</sup>C- und <sup>15</sup>N-Messungen an Sulmazol-Analoga haben gezeigt, daß sich in Abhängigkeit vom Lösungsmittel und Substitutionsmuster im Phenylring unterschiedliche Gleichgewichte zwischen 1H- und 3H-Tautomer einstellen. Wir konnten dies beim Vermessen verdünnter Proben (1–2 mg/ml) des Imidazo[4,5-*b*]pyridins **5b** in [D<sub>6</sub>]DMSO und CDCl<sub>3</sub> beobachten: Man beobachtet für die Methoxygruppe in **5b** im <sup>1</sup>H-NMR-Spektrum ([D<sub>6</sub>]DMSO) zwei Singulets, die das Vorliegen der tautomeren Formen **5b-1H** und **5b-3H** beweisen. Das Tautomenverhältnis beträgt ca. 1:1.

Im Lösungsmittel CDCl<sub>3</sub> fallen die beiden in DMSO beobachteten Singulets der Methoxygruppe zusammen. Denkbar ist, daß in CDCl<sub>3</sub> entweder ausschließlich ein Tautomer vorliegt, oder aber die individuellen Tautomere aufgrund sehr schneller Gleichgewichtseinstellung nicht getrennt beobachtet werden können. Zur Klärung dieser Frage haben wir Tieftemperaturmessungen von **5b** bis –40 °C in CDCl<sub>3</sub> durchgeführt: Bei 0 °C wurden für die Methoxygruppe (δ = 4.21 ppm bei 28 °C) zwei Singulets registriert. Das Tautomenverhältnis bei –40 °C betrug ca. 1:9 (δ = 4.23 und 4.18 ppm bei –40 °C).

## Experimenteller Teil

Allgemeine Angaben s. Lit.<sup>17)</sup>.

<sup>\*)</sup>: 1H- und 3H-Tautomer von **5a** bzw. **5b**; Abkürzungen: KG = Kieselgel; EE = Essigsäureethylester; RT = Raumtemp.; PE = Petrolether, 40–60 °C.

### 2,3-Diamino-6-methylpyridin (**2a**)

0.92 g (6 mmol) 2-Amino-6-methyl-3-nitropyridin (**1a**) werden in 30 ml EE gelöst und mit 450 mg Pd/C (10%) 1.5 h bei RT und 3.5 bar hydriert. Der Katalysator wird über Celite<sup>®</sup> 503 abfiltriert, der Ansatz eingengt und aus PE kristallisiert. Ausb. 0.74 g (93%) weiße Kristalle. Schmp. 68–69 °C (PE), Lit. 69–70 °C<sup>13)</sup>. C<sub>6</sub>H<sub>9</sub>N<sub>3</sub> (123.2). IR (KBr): 3369, 3205 (NH<sub>2</sub>); 1625 cm<sup>–1</sup> (C=C). UV (MeOH): λ max (lg ε) = 313 (3.95), 244 nm (3.95). <sup>1</sup>H-NMR ([D<sub>6</sub>]DMSO): δ (ppm) = 6.60 (d; 1H, H-4, J = 7.5 Hz), 6.20 (d; 1H, H-4, J = 7.5 Hz), 5.23 (s; 2H, 2-NH<sub>2</sub>, mit D<sub>2</sub>O austauschbar), 4.20 (br; 2H, 3-NH<sub>2</sub>, mit D<sub>2</sub>O austauschbar), 2.12 (s; 3H, 6-CH<sub>3</sub>). MS (70 eV): m/z (rel. Int.) = 123 (M<sup>+</sup>; 100), 122 (8), 106 (5), 96 (9), 95 (42), 82 (6), 81 (5), 80 (8), 79 (17), 70 (9), 68 (9), 65 (5), 55 (7), 54 (18), 53 (16), 52 (23), 51 (11).

### 2,3-Diamino-6-phenylpyridin (**2b**)

0.43 g (2 mmol) 2-Amino-3-nitro-6-phenylpyridin (**1b**) werden in 40 ml EE gelöst und nach Zugabe von 645 mg Pd/C (10%) 1.5 h bei RT und 3.5

bar hydriert. Nach Filtrieren über Celite<sup>®</sup> 503 wird eingengt und aus Methanol kristallisiert. Ausb. 0.35 g (96%) weißes bis leicht ockerfarbenes Pulver. Schmp. 76–77 °C (MeOH). C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>N<sub>3</sub> (185.1). IR (KBr): 3323, 3187 (NH<sub>2</sub>); 1631 cm<sup>–1</sup> (C=C). UV (MeOH): λ max (lg ε) = 328 (4.19), 279 (sh; 3.95); + H<sup>+</sup>: 355 nm (4.24). <sup>1</sup>H-NMR ([D<sub>6</sub>]DMSO): δ (ppm) = 7.93–7.83 (m; 2H, H-2', H-6'), 7.45–7.26 (m; 3H, H-3', H-4', H-5'), 6.99 (d; 1H, H-4, J = 7.8 Hz), 6.77 (d; 1H, H-5, J = 7.8 Hz), 5.44 (s; 2H, 2-NH<sub>2</sub>, mit D<sub>2</sub>O austauschbar), 4.90 (br; 2H, 3-NH<sub>2</sub>, mit D<sub>2</sub>O austauschbar). MS (70 eV): m/z (rel. Int.) = 186 (58), 185 (M<sup>+</sup>; 100), 184 (17), 170 (6), 169 (8), 168 (10), 167 (8), 159 (7), 158 (54), 157 (34), 141 (6), 140 (18), 132 (7), 131 (6), 130 (28), 115 (18), 114 (11), 113 (7), 105 (5), 104 (33), 103 (10), 102 (8), 93 (18), 89 (11), 88 (7), 80 (6), 79 (29), 78 (8), 77 (20), 76 (11), 75 (7), 74 (6), 66 (5), 65 (11), 64 (6), 63 (17), 62 (8), 55 (12), 54 (9), 52 (8), 51 (10), 50 (6).

### (2-[2-Methoxy-4-(methylthio)phenyl]-5-methylimidazo-1H-[4,5-*b*]pyridin (**4a**))

0.37 g (3 mmol) **2a** und 0.59 g (3 mmol) 2-Methoxy-4-(methylthio)benzoesäure (**3**) werden in 8 ml POCl<sub>3</sub> 30 min bei RT gerührt und anschließend 4.5 h unter Rückfluß erhitzt. Nach Einengen i. Vak. wird der Ansatz auf Eiswasser gegeben und mit NH<sub>3</sub>-Lösung (25%) pH 11 eingestellt. Der harzartige Ansatz wird über Nacht gerührt, der Niederschlag abfiltriert, zweimal mit H<sub>2</sub>O bis zur neutralen Reaktion digeriert und aus MeOH kristallisiert. Ausb. 0.61 g (71%) ockerfarbenes Pulver. Schmp. 101–102 °C (MeOH). C<sub>15</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>OS (285.4). Ber. C 63.1 H 5.30 N 14.7 Gef. C 63.3 H 5.35 N 14.5. IR (KBr): 3367–3306 (br; NH); 1618 cm<sup>–1</sup> (C=C). UV (MeOH): λ max (lg ε) = 337 (4.68), 273 (3.92), 244 nm (sh; 4.03). <sup>1</sup>H-NMR ([D<sub>6</sub>]DMSO): δ (ppm) = 8.23 (d, 1H, H-7, J = 8.5 Hz), 7.85 (d; 1H, H-6, J = 8.5 Hz), 7.2–7.0 (m; 4H, 3H arom. und NH, nach H/D-Austausch 3H), 4.03 (s; 3H, OCH<sub>3</sub>), 2.57 (s; 6H, SCH<sub>3</sub>, 5-CH<sub>3</sub>). MS (70 eV): m/z (rel. Int.) = 287 (11), 286 (32), 285 (M<sup>+</sup>; 100), 284 (50), 270 (12), 269 (11), 257 (8), 256 (32), 255 (37), 252 (7), 242 (22), 241 (32), 240 (68), 239 (8), 238 (8), 229 (5), 227 (9), 226 (10), 225 (8), 224 (12), 210 (9), 209 (13), 208 (24), 207 (5), 198 (5), 197 (6), 196 (8), 195 (7), 194 (7), 183 (6), 182 (6), 143 (6), 135 (5), 134 (34), 133 (6), 128 (14), 120 (5), 111 (9), 109 (6), 108 (24), 107 (7), 106 (5), 105 (10), 104 (7), 95 (5), 92 (7), 91 (5), 90 (5), 79 (8), 78 (13), 77 (5), 69 (8), 65 (6), 64 (7), 63 (9), 53 (5), 52 (10), 51 (6), 45 (8).

### 2-[2-Methoxy-4-(methylthio)phenyl]-5-phenylimidazo-1H-[4,5-*b*]pyridin (**4b**)

0.31 g (1.65 mmol) **2b** und 0.33 g (1.65 mmol) **3** werden in 8 ml POCl<sub>3</sub> 15 min bei RT gerührt und anschließend 5 h unter Rückfluß erhitzt. Nach Abdestillation des überschüssigen POCl<sub>3</sub> wird der Ansatz auf Eiswasser gegeben und mit NH<sub>3</sub>-Lösung (25%) pH 11 eingestellt. Der flockige Niederschlag wird abfiltriert, zweimal mit H<sub>2</sub>O bis zur neutralen Reaktion digeriert und aus MeOH kristallisiert. Ausb. 0.31 g (55%) ockerfarbenes Pulver. Schmp. 182–183 °C (MeOH). C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>OS (347.4). Ber. C 69.1 H 4.93 N 12.1 Gef. C 69.4 H 5.01 N 12.0. IR (KBr): 3425 (br; NH); 1600 cm<sup>–1</sup> (C=C). UV (MeOH): λ max (lg ε) = 365 (sh; 4.37), 350 (4.47), 309 (sh; 3.93), 239 (4.21); + H<sup>+</sup>: 367 nm (4.44). <sup>1</sup>H-NMR ([D<sub>6</sub>]DMSO): δ (ppm) = 8.27 (d; 1H, H-7, J = 8.4 Hz), 8.10–7.90 (m; 4H, 3H arom., NH, nach H/D-Austausch 3H), 7.80 (d; 1H, H-6, J = 8.4 Hz), 7.52–7.10 (m; 3H

aromat.), 7.08-6.99 (m; 2H arom.), 4.06 (s; 3H, OCH<sub>3</sub>), 2.59 (s; 3H, SCH<sub>3</sub>).- MS (70 eV): m/z (rel. Int.) = 349 (20), 348 (63), 347 (M<sup>+</sup>; 100), 346 (72), 332 (12), 331 (11), 319 (6), 318 (21), 317 (17), 304 (8), 303 (15), 302 (22), 271 (7), 270 (11), 258 (5), 197 (5), 196 (28), 195 (7), 174 (24), 170 (12), 168 (5), 159 (8), 152 (5), 141 (7), 140 (16), 128 (5), 115 (7), 114 (6), 77 (7), 63 (6).

(±)-2-[2-Methoxy-4-(methylsulfinyl)phenyl]-5-methylimidazo-1H-[4,5-b]pyridin (5a)

Zur Lösung aus 0.43 g (1.5 mmol) 4a in 20 ml Eisessig läßt man langsam 0.35 ml (3.1 mmol) H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> (30%) tropfen und rührt anschließend 6 h bei RT. Nach Einengen des Ansatzes i. Vak. und Verdünnen mit 65 ml H<sub>2</sub>O wird mit NH<sub>3</sub>-Lösung (25%) pH 9 eingestellt. Die Lösung wird mit NaCl gesättigt, dreimal mit CHCl<sub>3</sub> ausgeschüttelt und die vereinigte org. Phase über Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> getrocknet. Der nach Einengen verbleibende Rückstand wird sc an KG (CHCl<sub>3</sub>/MeOH:95+5) gereinigt und mit MeOH kristallisiert.- Ausb. 0.34 g (75%) ockerfarbenes Pulver.- Schmp. 188-189 °C (MeOH).- C<sub>15</sub>H<sub>15</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S (301.4) Ber. C 59.8 H 5.02 N 13.9 Gef. C 59.8 H 5.05 N 13.6.- IR (KBr): 3457-3400 (br; NH); 2921 (CH<sub>3</sub>); 1618 (C=C); 1038; 1022 cm<sup>-1</sup> (S=O).- UV (MeOH): λ max (lg ε) = 348 (4.38), 332 (4.52), 305 (sh; 4.17), 258 (3.74), 240 nm (sh; 3.78).- <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ (ppm) = 11.0 (s; 1H, NH, mit D<sub>2</sub>O austauschbar), 8.69 (d; 1H, H-7, J = 8 Hz), 7.95 (d; 1H, H-6, J = 8 Hz), 7.55 (d; 1H, H-3', J = 1.5 Hz), 7.22 (dd; 1H, H-5', J<sub>1</sub> = 8, J<sub>2</sub> = 1.5 Hz), 7.13 (d; 1H, H-6', J = 8 Hz), 4.16 (s; 3H, OCH<sub>3</sub>), 2.79 (s; 3H, SOCH<sub>3</sub>), 2.67 (s; 3H, 5-CH<sub>3</sub>).- <sup>1</sup>H-NMR ([D<sub>6</sub>]DMSO, 360 MHz): δ (ppm) = 8.70 (d; 1H, H-7, J = 8 Hz), 7.96 (d; 1H, H-6, J = 8 Hz), 7.7-7.5 (m; 3H, H-3', H-5', NH, nach H/D-Austausch 2H), 7.13 (d; 1H, H-6', J = 7.8 Hz), 4.11 und 4.07<sup>x</sup>) (je s; je 1.5 H, OCH<sub>3</sub>), 2.84 (s; 3H, SOCH<sub>3</sub>), 2.58 (s; 3H, 5-CH<sub>3</sub>).- MS (70 eV): m/z (rel. Int. ≥ 10) = 302 (32), 301 (M<sup>+</sup>; 100), 288 (10), 287 (31), 286 (94), 285 (33), 284 (10), 268 (6), 258 (37), 256 (20), 254 (14), 242 (10), 241 (17), 240 (20), 238 (22), 237 (19), 228 (23), 224 (13), 210 (27), 209 (31), 208 (34), 207 (13), 196 (11), 195 (12), 194 (17), 193 (11), 114 (10), 105 (12), 78 (16), 65 (10), 64 (11), 63 (12), 52 (15).

(±)-2-[2-Methoxy-4-(methylsulfinyl)phenyl]-5-phenylimidazo-1H-[4,5-b]pyridin (5b)

Zur Suspension aus 0.17 g (0.5 mmol) 4b in 7 ml Eisessig läßt man langsam 0.12 ml (1.05 mmol) H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> (30%) tropfen und rührt anschließend 24 h bei RT, wobei der Ansatz nach 8 h klar wird. Nach Einengen der Lösung i. Vak. und Verdünnen mit 5 ml H<sub>2</sub>O wird mit NH<sub>3</sub>-Lösung (25%) pH 9 eingestellt. Die Lösung wird mit NaCl gesättigt, dreimal mit CHCl<sub>3</sub> ausgeschüttelt und die vereinigte org. Phase über Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> getrocknet. Der nach Einengen verbleibende Rückstand wird sc an KG (CHCl<sub>3</sub>/MeOH 98+2) gereinigt und mit MeOH kristallisiert.- Ausb. 0.13 g (69%) ockerfarbenes Pulver.- Schmp. 126-127 °C (MeOH).- C<sub>20</sub>H<sub>17</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S (363.4) Ber. C 66.1 H 4.71 N 11.6 Gef. C 65.8 H 5.06 N 11.2.- IR (KBr): 3426 (br; NH); 1611 (C=C); 1045; 1026 cm<sup>-1</sup> (S=O).- UV (MeOH): λ max (lg ε) = 344 (4.63), 235 nm (sh; 4.35).- <sup>1</sup>H-NMR (360 MHz, [D<sub>6</sub>]DMSO): δ (ppm) = 8.59 und 8.56<sup>x</sup>) (je d; je 0.5 H, H-7, J = 8 Hz), 8.06-8.01 (m; 2.5 H aro-

mat. (2H), H-6' (0.5 H)), 8.08 (d; 0.5 H, H-6', J = 8 Hz), 7.89 und 7.86<sup>x</sup>) (je d; je 0.5 H, H-6, J = 8 Hz), 7.56-7.40 (m; 3H arom., H-3', H-5', NH, nach H/D-Austausch 2H), 4.14 und 4.09<sup>x</sup>) (je s; je 1.5 H, OCH<sub>3</sub>), 2.86 und 2.85<sup>x</sup>) (je s; je 1.5 H, SOCH<sub>3</sub>).- <sup>1</sup>H-NMR (360 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ (ppm) = 11.0 (s; 1H, NH, mit D<sub>2</sub>O austauschbar), 8.73 (d; 1H, H-7, J = 8 Hz), 8.14 (d; 1H, H-6', J = 8 Hz), 8.06-8.01 (m; 2H, arom.), 7.75 (d; 1H, H-6, J = 8 Hz), 7.59 (d; 1H, H-3', J = 1.5 Hz), 7.54-7.41 (m; 3H, arom.), 7.23 (dd; 1H, H-5', J<sub>1</sub> = 8, J<sub>2</sub> = 1.5 Hz), 4.21 (s; 3H, OCH<sub>3</sub>), 2.82 (s; 3H, SOCH<sub>3</sub>).- MS (70 eV): m/z (rel. Int.) = 364 (20), 363 (M<sup>+</sup>; 83), 362 (7), 350 (7), 349 (23), 348 (100), 347 (15), 346 (5), 331 (7), 330 (7), 321 (5), 320 (22), 318 (7), 316 (9), 304 (5), 303 (6), 302 (5), 300 (9), 299 (6), 290 (5), 272 (13), 271 (15), 270 (19), 258 (5), 257 (5), 256 (7), 196 (12), 182 (7), 179 (6), 170 (5), 169 (5), 168 (6), 154 (5), 152 (5), 145 (5), 142 (7), 141 (11), 140 (23), 136 (6), 128 (8), 127 (6), 123 (6), 116 (6), 115 (15), 114 (13), 113 (6), 104 (5), 103 (5), 102 (7), 89 (5), 77 (7), 63 (5), 47 (8).

## Literatur

9. Mitt.: R. Troschütz und A. Lückel, Arch. Pharm. (Weinheim), im Druck (Ph 37).
- Teilergebnis der Dissertation A. Lückel, Erlangen 1991.
- H. von der Leyden und W. Meyer, Arzneim.ther. 9, 42 (1991).
- V. Austel und E. Kutter, Arzneim. Forsch. 31, 130 (1981).
- E. Kutter und V. Austel, Arzneim. Forsch. 31, 130 (1981).
- W. Wiegerebe, Pharm. Ztg. 134, 1239 (1989).
- E. Kutter, V. Austel, W. Diederer, Ger. Offen. 2,305,339, C.A. 82, 4251 y (1975).
- V. Austel, J. Heider, N. Huel, M. Reiffen, J. Nickl, J.C.A. van Meel und W. Diederer, Ger. Offen. DE 3347290, C.A. 103, 37476f (1985).
- V. Austel, J. Heider, N. Huel, M. Reiffen, J. Nickl, J.C.A. von Meel und W. Diederer, Ger. Offen. DE 3347290, C.A. 104, 5871 k (1986).
- P. Barraclough, J.W. Black, D. Cambridge, V.P. Gerskowitch, R.A.D. Hull, R. Lye, W.R. King, C.O. Kneen, M.S. Nobbs, G.P. Shah, S. Smith, S.J. Vine und M.V. Whiting, Arch. Pharm. (Weinheim) 323, 501 (1990).
- P. Barraclough, J.W. Black, D. Cambridge, D. Collard, D. Firmin, V.P. Gerskowitch, R.C. Glen, H. Giles, A.P. Hill, R.A.D. Hull, R. Iyer, W.R. King, C.O. Kneen, J.C. Lindon, M.S. Nobbs, P. Randell, G.P. Shah, S. Smith, S.J. Vine, M.V. Whiting und J.M. Williams, J. Med. Chem. 33, 2231 (1990).
- H. Mertens, R. Troschütz und H.J. Roth, Liebigs Ann. Chem. 1986, 380.
- G.L. Lappin und F.B. Slezak, J. Am. Chem. Soc. 72, 2806 (1950).
- E. Pretsch, J. Seibl, T. Clerc und W. Simon, Tabellen zur Strukturaufklärung organischer Verbindungen mit spektroskopischen Methoden (Hrsg. W. Fresenius, J.F.K. Huber, E. Pungor, W. Simon und T.S. West), 3. Aufl., Springer Verlag, Berlin 1986.
- 3H-Form = 1H-Imidazo[5,4-b]pyridin.
- P. Barraclough, D. Firmin, R. Iyer, W.R. King, J.C. Lindon, M.S. Nobbs, S. Smith, C.J. Wharton und J.M. Williams, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 2 1988, 1839.
- R. Troschütz und A. Lückel, Arch. Pharm. (Weinheim) 324, 73 (1991). [KPh 582]