

C 07 C 127

Ans.nr.: 5548/84

Indleveret: 22 nov 1984

Løbedag: 22 nov 1984

Alm. tilgængelig: 24 maj 1985

Prioritet: 23 nov 1983 US 554852

*CIBA-GEIGY AG; Basel, CH.

Opfinder: Lincoln Harvey *Werner; US.

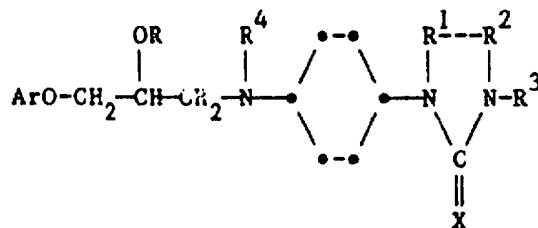
Fuldmægtig: Dansk Patent Kontor ApS

Fremgangsmåde til fremstilling af urinstof-
forbindelser

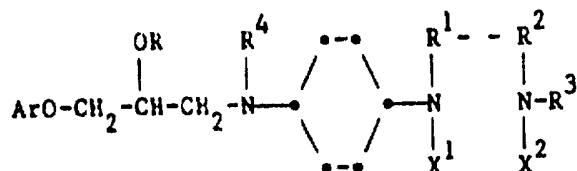
SAMMENDRAG

5548-84

3-(Ureido- og thioureido-cyclohexylamino)-propan-1,2-diol-
forbindelser med formlen



Ar betyder en monocyklisk eller eventuel partiel mættet bicyclisk, carbocyclisk eller heterocyclisk aromatisk gruppe, R er H, alkanoyl eller aroyl, R¹ og R² hver for sig er H eller alkyl, eller R¹ og R² sammen betyder alkylen, R³ og R⁴ betyder H eller alkyl, og X er O eller S, eller salte deraf fremstilles ved, at man omsætter to forbindelser med hinanden eller cycliserer en forbindelse, idet disse forbindelser eller forbindelsen har formlen



hvor en af grupperne X^1 og X^2 betyder H og den anden acylgruppen af et kulsyrehalvderivat, eller hvor X^1 sammen med R^1 eller X^2 sammen med R^2 betyder gruppen $=C=X$ (IVa), idet X^2 er H og R^2 H eller alkyl eller X^1 er H og R^1 er H eller alkyl, og idet funktionelle grupper, som ikke deltager i reaktionen, i udgangsforbindelsen eller udgangsforbindelserne med formlen IV kan være beskyttede, og omdanner eventuelle beskyttede funktionelle grupper til frie funktionelle grupper og, om ønsket, omdanner en forbindelse med formlen I til en anden forbindelse med formlen I og/eller, om ønsket, omdanner en fremstillet fri forbindelse til et salt eller et dannet salt til en fri forbindelse eller et andet salt og/eller, om ønsket, adskiller en fremstillet isomerblanding i diisomerer.

Forbindelserne I har antihypertensiv virkning og virkning på hjertefunktionen.