

C 07 D 405

Ans.nr.: 1070/84

Indleveret: 27 feb 1984

Løbedag: 27 feb 1984

Alm. tilgængelig: 29 aug 1984

Prioritet: 28 feb 1983 US 470405

09 jan 1984 US 569122

*JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.; Beerse, BE.

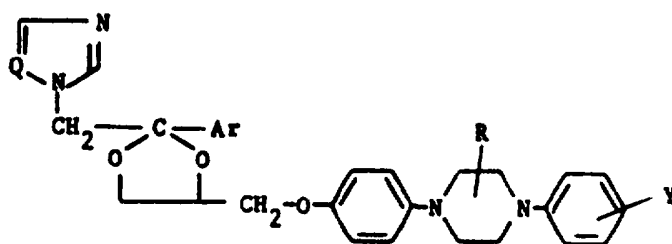
Opfinder: Jan *Heeres; BE, Raymond A. *Stokbroekx; BE, Leo J.J. *Backx; BE.

Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S
((4-(4-(4-Phenyl-1-piperazinyl)phenoxy-methyl)-1,3-dioxolan-2-yl)methyl)1H-imidazoler og 1H-1,2,4-triazoler

SAMMENDRAG

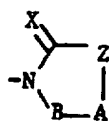
1070-84

Substituerede [[4-[4-(4-phenyl-1-piperazinyl)phenoxy-methyl]-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazoler og -1H-1,2,4-triazoler med formlen



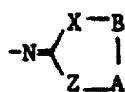
(I)

et farmaceutisk acceptabel syreadditionsalt eller stereokemisk isomere former heraf, hvori Q er -N= eller -CH=, Ar er phenyl eller substitueret phenyl, hvilken substitueret phenyl har fra 1 til 3 substituent, der uafhængigt af hinanden er udvalgt fra gruppen bestående af halogen, lavere alkyl, lavere alkyloxy, nitro, amino og trifluormethyl, R er hydrogen eller lavere alkyl, og Y er en gruppe med formlen



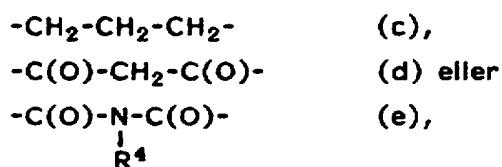
(a)

eller en gruppe med formelen



(b)

hvor Z er O eller NR^1 , hvor R^1 er hydrogen, lavere alkenyl, lavere alkynyl, Ar, cycloalkyl, lavere alkyl, der eventuelt er substitueret med et element udvalgt fra gruppen bestående af Ar, lavere alkyloxy og cycloalkyl; pyrimidin, der eventuelt er substitueret med op til to substituentter udvalgt fra gruppen bestående af lavere alkyl, amino, nitro, hydroxy, lavere alkyloxy, lavere alkylthio, halogen, phenyl, carboxyl og lavere alkyloxycarbonyl; X er O, S eller NR^2 , hvor R^2 er hydrogen eller lavere alkyl, A er $>\text{C}=\text{O}$, NR^3 eller methylen, der eventuelt er substitueret med op til to grupper udvalgt fra gruppen bestående af lavere alkyl og Ar, hvor R^3 er hydrogen eller lavere alkyl, eller R^1 og R^3 danner tilsammen en lavere alkandiyldgruppe, forudsat at, når A er NR^3 , er Z forskellig fra oxygen, og B er $>\text{C}=\text{O}$ eller methylen, der eventuelt er substitueret med op til to grupper udvalgt fra gruppen bestående af lavere alkyl og lavere alkyloxy, eller A og B danner tilsammen en bivalent gruppe med formelen



1070-84

hvor R^4 er hydrogen eller lavere alkyl, eller hvor Y er en gruppe med formelen (b), eller A og B danner tilsammen en bivalent gruppe med formelen



hvor ét hydrogenatom i gruppen (g) og op til to hydrogenatomer i grupperne (c), (d) eller (f) kan være erstattede af en lavere alkylgruppe, forudsat at, når $-A-B-$ er en gruppe med formelen (g), er ovennævnte gruppe bundet til Z med dets nitrogenatom og ovennævnte Z er forskellig fra O, har antimikrobielle egenskaber og er særligt anvendelige til behandlingen af vaginal candidosis.

