

C 07 C 153

Ans.nr.: 1497/82

Indleveret: 01 apr 1982

Løbedag: 01 apr 1982

Alm. tilgængelig: 03 okt 1982

Prioritet: 02 apr 1981 CA 374469

*AYERST MCKENNA & HARRISON INC.; St. Laurent, CA.

Opfinder: Gervais *Dionne; CA, Francesco *Bellini; CA, Kazimir *Sestanj; CA.

Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

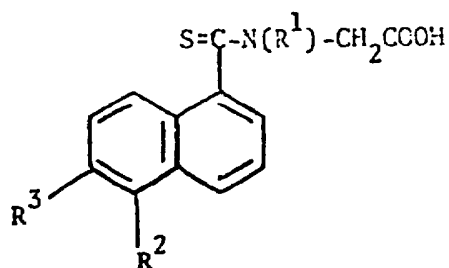
Fremgangsmåde til fremstilling af N-((1-naphthalenyl)-thioxomethyl)glycinderivater

S A M M E N D R A G

1497-82

N-((1-Naphthalenyl)-thioxomethyl)glycinderivater

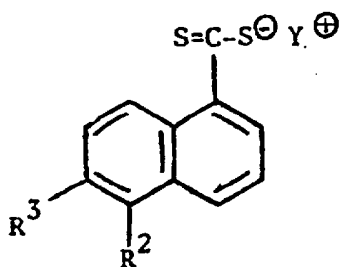
med formlen



I

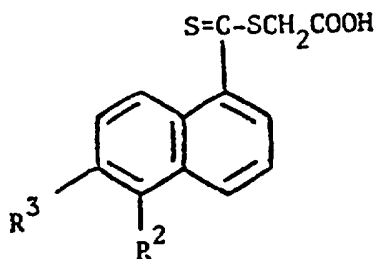
hvor R^1 er lavere alkyl, R^2 er hydrogen, lavere alkyl, lavere alkoxy, halogen eller trifluormethyl, og R^3 er hydrogen, lavere alkyl, lavere alkoxy eller trifluormethyl, fremstilles ved, at

a) en forbindelse med formlen



II

hvor R^2 og R^3 har den ovenfor anførte betydning, og Y er Mg-(kompleks), Li, Na eller K, forudst at når Y er Mg-(kompleks) eller Li, er R^2 ikke brom, chlor eller iod, under neutrale eller alkaliske betingelser omsættes med en halogeneddikesyre til opnåelse af den tilsvarende forbindelse med formelen



III

hvor R^2 og R^3 har den ovenfor anførte betydning, og at forbindelsen med formlen III under neutrale eller alkaliske betingelser kobles med en aminosyre med formlen $\text{HN}(R^1)\text{CH}_2\text{COOH}$, hvor R^1 er lavere alkyl, eller

b) en forbindelse med formlen II omsættes med en aminosyre med formlen $\text{HN}(R^1)\text{CH}_2\text{COOH}$, hvor R^1 er lavere alkyl, under neutrale eller alkaliske betingelser.

Forbindelserne med formlen I er inhibitorer af aldosereductase og er følgelig anvendelige til behandling af komplikationer ved diabetes.