



Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 3129/89 (51) Int. Cl. 5: C 07 D 211/90
 (22) Indleveringsdag:.... 23 jun 1989 C 07 C 229/22
 (24) Løbedag:..... 23 jun 1989 C 07 C 233/47
 (41) Alm. tilgængelig:.... 25 dec 1989 C 07 C 233/85
 (62) Stamansøgningsnummer:..... C 07 C 271/22
 (86) International ansøgning nr.:... - C 07 C 275/42
 (86) International indleveringsdag: C 07 C 311/06
 (85) Videreførselsdag: C 07 C 311/19
 (30) Prioritet: 24 jun 1988 DE 3821334
 (71) Ansøger: *Bayer Aktiengesellschaft, D-5090 Leverkusen, DE
 (72) Opfinder: Juergen *Stoltefuss, Parkstrasse 20; D-5657 Haan, DE
 Martin *Bechem, Obere Bergerheide 4; D-5600 Wuppertal 1, DE
 Rainer *Gross, Platzhofstrasse 23; D-5600 Wuppertal 1, DE
 Siegbert *Hebisch, Richard-Seel-Weg 11; D-5600 Wuppertal 1, DE
 Matthias *Schramm, Paffrather Strasse 38; D-5000 Koeln 80, DE
 (74) Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co., H.C. Andersens Boulevard 4
 , 1553, København V

- (54) 1,4-Dihydropyridin-threonin-derivater og fysiologisk uskadelige salte
 deraf, deres fremstilling og anvendelse samt mellemprodukter til
 fremstillingen

- (57) Sammendrag

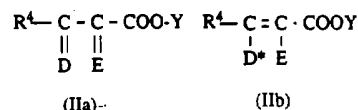
3129-89

Dihydropyridinderivater med formel (I)



og deres fysiologisk uskadelige salte er farmaceutisk aktive
 med virkning på blodkredsløbet.

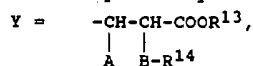
Forbindelser med formel (II)



er hidtil ukendte mellemprodukter ved fremstillingen af
 forbindelserne (I).

Forbindelserne I omdannes let (til forskel fra kendte
 dihydropyridinestere) til de frie syrer ved fraspaltning af
 Y og optagelse af H.

Symbolbetydninger:



fortsættes

3129-89

- A = H eller CH₃,
B = NH, NHCO, NHCS, NHCOO, NH₂SO₂, NHCONH eller NHCSNH,
R¹, R⁴, R¹³ og R¹⁴ = eventuelt substitueret alkyl eller aryl,
R¹, R⁴ og R¹³ tillige cycloalkyl, R¹ og
R¹⁴ tillige mono-, bi- eller tricyclisk
heterocyclyl, R¹³ og R¹⁴ tillige H,

R² = NO₂, CN, halogen, eventuelt substitueret phenyl eller
carboxylsyre-, phosphorsyre- eller sulfonsyrederiva-
ter,
R³ = eventuelt substitueret alkyl eller CN; eller
R² og R³ sammen en eventuelt umættet, 5- til 7-leddet ring,
eventuelt med =CH-, -CH₂-, O, CO, CS, S eller -N=
som yderligere ringled,
D = O eller NH,
D* = OH eller NH₂,
E = H eller i IIa tillige = CHR¹.