

(19) DANMARK

Danske Patentansøgninger uge 29/13-07-92  
Sammendrag og tegninger Sektion C 07 og C 12



(12) PATENTANSØGNING (10) DK 0393/92 L

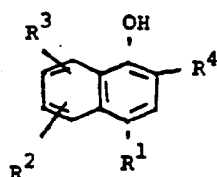
Patentdirektoratet

- |   |                               |
|---|-------------------------------|
| (21) Patentansøgning nr. : 0393/92      | (51) Int. Cl. 5: C 07 C 39/14 |
| (22) Indleveringsdag:.... 25 mar 1992   | C 07 C 39/17                  |
| (24) Løbedag:..... 07 maj 1986          | C 07 C 39/225                 |
| (41) Alm. tilgængelig:.... 25 mar 1992  | C 07 C 39/23                  |
| (62) Stamansøgningsnummer:..... 2112/86 | C 07 C 39/38                  |
| (86) International ansøgning nr. :.. -  | C 07 C 43/178                 |
| (86) International indleveringsdag:     | C 07 C 43/23                  |
| (85) Videreførselsdag:                  | C 07 C 43/295                 |
|   | C 07 C 49/83                  |
|   | C 07 C 59/68                  |
|   | C 07 C 65/11                  |
|   | C 07 C 69/712                 |
|   | C 07 C 69/732                 |
|   | C 07 C 69/94                  |
|   | C 07 C 215/54                 |
|   | C 07 C 215/74                 |
|   | C 07 C 235/34                 |
|   | C 07 C 235/66                 |
|   | C 07 C 255/36                 |
|   | C 07 C 311/29                 |
|   | C 07 C 317/22                 |
|   | C 07 C 323/16                 |
|   | C 07 C 323/18                 |
|   | C 07 C 327/56                 |
|   | C 07 D 207/333                |
|   | C 07 D 213/30                 |
|   | C 07 D 295/096                |
|   | C 07 D 295/182                |
|   | C 07 D 307/42                 |
|   | C 07 D 333/16                 |
- (30) Prioritet: 08 maj 1985 US 731791 19 mar 1986 US 839912  
(71) Ansøger: The du \*Pont Merck Pharmaceutical Company, Barley Mill Plaza;  
Wilmington; Delaware 19880, US  
(72) Opfinder: Douglas Guy \*Batt, 302 Cleveland Avenue; Wilmington; Delaware  
19803, US  
(74) Fuldmægtig: Budde, Schou & Co. A/S, Sundkrogsgade 10, 2100, København Ø

- (54) 2-Substituerede 1-naphtholer og fremgangsmåde til deres fremstilling  
(57) Sammendrag

393-92

2-Substituerede 1-naphtholer med formelen



(II)

hvor

R<sup>1</sup> betyder H, CH<sub>3</sub>, Br, Cl, OH, OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, COR<sup>17</sup>, COOR<sup>18</sup>,  
CONR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>, phenyl, -N(R<sup>12</sup>)(R<sup>13</sup>), -NHC-lavere-



fortsættes

-alkyl,  $S(O)_p$ -lavere alkyl, hvor p er 0, 1 eller 2,  $SO_2NH_2$  eller  $-NHSO_2$ -lavere alkyl eventuelt substitueret med F,  $R^2$  og  $R^3$  hver især betyder H,  $CH_3$ ,  $C_2H_5$ ,  $OCH_3$  eller  $OC_2H_5$ ,  $R^4$  er ligekædet eller forgrenet alkynyl med 2 til 12 carbonatomer, cycloalkenyl med 5 til 7 carbonatomer,  $CH_2-C\equiv C-(CH_2)_mR^5$ , hvor m er 1 til 4,  $CH=XH-(CH_2)_nR^5$ , hvor n er 1 til 3, og den olefiniske binding enten har Z- eller E-konfiguration, A- $R^6$  eller  $CHR^7$ , hvor

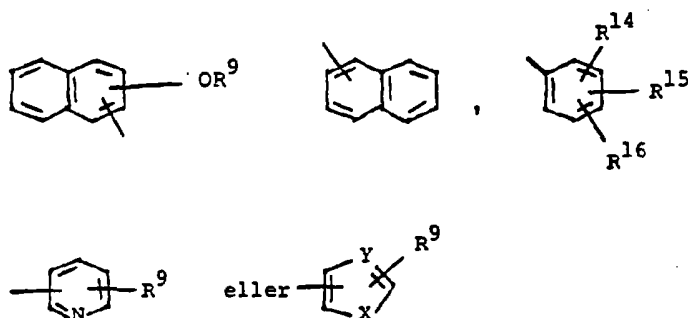
$$\begin{array}{c} | \\ R^{21} \end{array}$$

A er en kæde med 2 til 6 methylengrupper,

$R^5$  betyder  $C_{5-7}$ -cycloalkyl, phenyl eller  $COOR^9$ ,

$R^6$  betyder  $C_{3-6}$ -alkenyl,  $C_{5-7}$ -cycloalkyl,  $CON(R^{12})(R^{13})$ ,  $CN$ ,  $CH(COOR^9)_2$ ,  $C(R^{10})(R^{11})OR^9$ ,  $P(O)(OR^9)_2$ ,  $S(O)_wR^9$ , hvor w er 0 til 2, idet dog såfremt w er 1,  $R^9$  da er forskellig fra H, betyder  $SC(NH)NH_2$ ,  $N(R^{12})(R^{13})$ ,  $OR^9$ , Cl, Br eller I,

$R^7$  betyder  $C_{3-8}$ -cycloalkyl,



hvor X betyder S, O eller  $NH^{10}$ , og Y betyder CH eller N,  $R^9$ ,  $R^{10}$  og  $R^{11}$  hver især betyder H eller  $C_{1-4}$ -alkyl,  $R^{12}$  og  $R^{13}$  tilsammen betyder  $(CH_2)_{4-5}$ ,

$R^{14}$  betyder  $C_{1-4}$ -alkyl,  $OR^9$ , O-phenyl,  $OCH_2COOR^9$ , O-benzyl,  $COOR^9$ ,  $CF_3$ , Cl, Br, I,  $N(R^{12})(R^{13})$  eller  $S(O)_wR^9$ , hvor w er 0 til 2, idet dog såfremt w betyder 1,  $R^9$  da er forskellig fra H, og

$R^{15}$  og  $R^{16}$  hver især betyder H,  $C_{1-4}$ -alkyl,  $OR^9$ , O-benzyl, F eller Cl,

$R^{17}$  betyder lavere alkyl, phenyl, eventuelt monosubstitueret med Cl, Br, F,  $CH_3$ ,  $CH_3O$ , pyridyl, thienyl eller furyl,

$R^{18}$  betyder H eller lavere alkyl,

$R^{19}$  og  $R^{20}$  hver især betyder H eller lavere alkyl eller tilsammen betyder  $(CH_2)_{4-5}$ , og

$R^{21}$  betyder H, lavere alkyl, phenyl, eventuelt monosubstitueret med Cl, Br, F,  $CH_3O$ , pyridyl, thienyl eller furyl, eller et farmaceutisk acceptabelt salt deraf,

der fremstilles ved forskellige fremgangsmåder,

er 5-lipoxigenaseinhibitorer, som gør dem anvendelige til behandling af inflammation, lungesygdomme og psoriasis.