

A 61 K 49
 C 07 C 103/75
 Indleveret: 30 sep 1983
 Løbedag: 30 sep 1983
 Alm. tilgængelig: 02 apr 1984
 Prioritet: 01 okt 1982 GB 8228067
 *NYEGAARD & CO. A/S; Oslo, NO.
 Opfinder: Knut *Wille; NO.
 Fuldmægtig: Kontor for Industriel Eneret
 Røntgenkontraststof

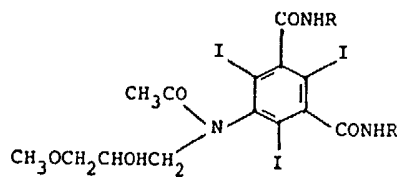
Ans.nr.: 4519/83

Sammendrag

Røntgenkontraststof

Forbindelser med den almene formel

4519-83



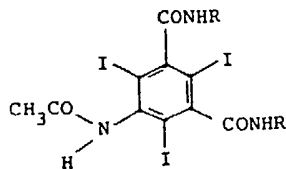
I

hvor R betegner $-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OH})_2$ eller $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{OH}$ har en række
 gunstige egenskaber, nemlig foruden lav toxicitet, lav osmola-
 ritet, høj stabilitet, simpel fremstilling og evne til at
 danne vandige opløsninger med høj koncentration og lav osmola-
 ritet, og desforuden høj stabilitet mod udkrystallisation
 fra vandige opløsninger, selv i nærværelse af pødekrystaller.
 Disse egenskaber gør dem velegnede som almene røntgenkontrast-

stoffer ikke blot ved alle former for intravaskulær synliggørelse såsom urografi og cerebral, coronær og perifer angiografi, men tillige i myelografi.

Forbindelserne eksisterer dels som endo- og-exo-isomerer, dels i racemisk form og optisk aktive former, der alle kan anvendes som røntgenkontraststoffer.

Forbindelserne fremstilles ved omsætning af den tilsvarende 5-monoacetylaminoforbindelse



II

med et reagens til indførelse af 2-hydroxy-3-metoxypropylgruppen, fx en forbindelse $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CHOHCH}_2\text{X}$ (III) hvor X er et atom eller en gruppe der kan fjernes som anion. En forbindelse II kan fremstilles fx ved omsætning af 5-acetamido-2,4,6-trijodisofthaloylchlorid og/eller 5-diacetyl-amino-2,4,6-trijodisofthaloylchlorid med 1,3- eller 2,3-dihydroxypropylamin efterfulgt, når 5-diacetylaminoforbindelsen er anvendt, af fjernelse af den ene N-acetylgruppe, fx ved alkalisk hydrolyse.