

C 07 D 513

Ans.nr.: 1854/85

Indleveret: 25 apr 1985

Løbedag: 25 apr 1985

Alm. tilgængelig: 28 okt 1985

Prioritet: 27 apr 1984 US 604687

ELI *LILLY AND COMPANY; Indianapolis, US.

Opfinder: Robert Daniel *Titus; US, Edmund Carl *Kornfeld; US.

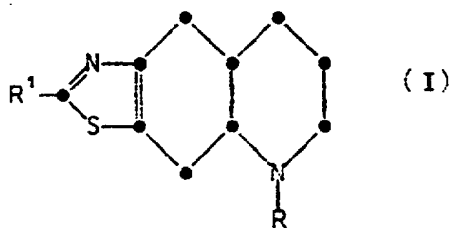
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Trans-(+), (-)-octahydrothiazolo[4,5-g]quinoliner og enantiomere deraf samt fremgangsmåde til fremstilling af sådanne forbindelser

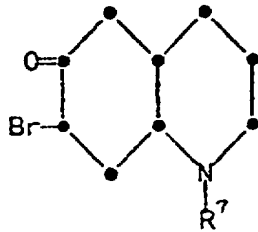
SAMMENDRAG

1854-85

Trans-(±)-octahydrothiazolo[4,5-g]quinoliner og enantiomere deraf med formlen



hvor R = H, benzyl, methyl, ethyl, n-propyl eller allyl, og R¹ = H, OH, halogen, methyl, NH₂, NH(C₁₋₃ alkyl), N(C₁₋₃ alkyl)₂, 1-pyrrolidinyll, NHCO(C₁₋₃ alkyl) eller NH(C₁₋₃ alkylphenyl) eller farmaceutisk acceptable syre-additionssalte deraf, fremstilles ved en række reaktioner eksempelvis udfra cyklisering af en forbindelse



(V)

, hvori R⁷ er som

R med undtagelse af allyl, med en forbindelse:

SH

|

R⁴ - C = NH (IV), hvori R⁴ er H, CH₃, NH₂, NH(C₁₋₃ alky), N(C₁₋₃ alkyl)₂ eller NH(C₁₋₂ alkylphenyl), og videreudskiftning af R¹-gruppen, eventuel opløsning af racemater til optisk aktive enantiomere og/eller saltdannelse.

Forbindelserne er D-2-dopamin-agonister med et bredt spektrum af fysiologisk aktivitet og er derfor anvendelige som lægemidler til pattedyr herunder mennesker.