

C 07 D 233

Ans.nr.: 2643/82

Indleveret: 11 jun 1982

Løbedag: 11 jun 1982

Alm. tilgængelig: 12 dec 1983

Prioritet: -

A/S *DUMEX (DUMEX LTD.); København, DK.

Opfinder: Pia *Thorbek; DK, Hans *Bundgaard;
DK, Claus *Larsen; DK.

Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Lehmann & Ree

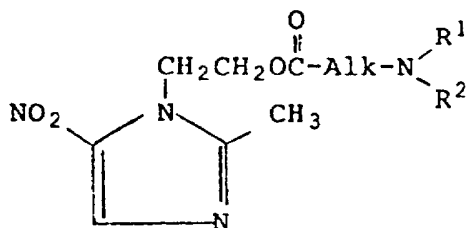
Fremgangsmåde til fremstilling af nitroimi-
dazol-derivater

S A M M E N D R A G

2643-82

"Fremgangsmåder til fremstilling af nitroimidazol-derivater".

Hidtil ukendte nitroimidazol-derivater (metronidazol-derivater) med
formlen:



- hvor R¹ og R² har samme eller forskellig betydning, og hver betegner hydrogen eller alkyl, der kan være lige eller forgrenet med 1-5 carbonatomer - eller R¹ og R² kan, sammen med det nitrogenatom til hvilket de er bundet, danne en heterocyklisk ring, som kan indeholde andre heteroatomer, der kan være oxygen eller >N-R³, hvor R³ betegner hydrogen eller lavere alkyl, Alk betegner en lige eller forgrenet alkylenkæde med 1-4 carbonatomer, samt fysiologisk tolerable salte og hydrater deraf -

fremstilles ved a) alkylering af en amin med en halogen-substitueret metronidazolester eller ved b) omsætning af metronidazol med en aminocarboxylsyre eller et funktionelt reaktionsdygtigt derivat heraf.

Sådanne aminocarboxylsyre-estere af metronidazol hydrolyseres hurtigt og fuldstændigt til metronidazol i blodet. Da forbindelserne - i modsætning til metronidazol selv - er meget vandopløselige kan de administreres som injektionsvæske.