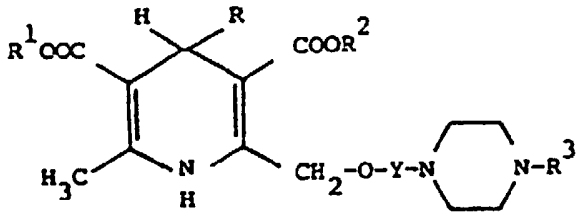
C 07 D 211 Ans.nr.: 3983/83
Indleveret: 01 sep 1983
Løbedag: 01 sep 1983
Alm. tilgængelig: 05 mar 1984
Prioritet: 04 sep 1982 GB 8225246
*PFIZER CORPORATION; Colon, PA.
Opfinder: Simon Fraser *Campbell; GB, Peter Edward *Cross; GB, John Kendrick *Stubbs; GB.
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman–Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af 1,4–dihydropyridinderivater eller farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf

SAMMENDRAG:

3983-83

1,4-dihydropyridin-derivater med formlen



--- (I)

hvori R er aryl eller heteroaryl, R^1 og R^2 hver for sig er (C_1-C_4)alkyl eller 2-methoxyethyl, Y er $-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_3-$, $-CH_2CH(CH_3)-$ eller $-CH_2C(CH_3)_2-$, og R^3 er hydrogen eller en gruppe valgt blandt:

(a) $-\overset{\overset{X}{\|}}{C}.NHR^4$ (b) $-\overset{\overset{O}{\|}}{C}.N((C_1-C_4)alkyl)_2$, (c) $-\overset{\overset{N.CN}{\|}}{C}-R^5$

(d) $-C(=N.SO_2R^6)-NH(C_1\text{-}C_4\ \text{alkyl})$ (e) $-C(=NH)-NHR^7$

(f) $-C(=N.CO(C_1\text{-}C_4)\text{alkyl})-NH.CO(C_1\text{-}C_4)\text{alkyl}$ (g) $-C(SCH_3)=N.R^8$ (h) $-CH_2CO.R^9$

(i) $-SO_2.R^{10}$ (j) $-CO.R^{11}$

hvor R^4 er H, $(C_1\text{-}C_4)$alkyl, $(C_3\text{-}C_6)$cycloalkyl, $-COO(C_1\text{-}C_4)$-alkyl, $-CH_2COO(C_1\text{-}C_4)$alkyl, aryl, $-SO_2$.aryl eller heteroaryl, X er O eller S,
R^5 er 1-pyrrolidinyl, $-NH_2$, $-NH(C_1\text{-}C_4)$alkyl, $-N((C_1\text{-}C_4)$-alkyl) eller $-NH(CH_2)_2N((C_1\text{-}C_4)\text{alkyl})_2$,
R^6 er $(C_1\text{-}C_4)$alkyl eller aryl,
R^7 er $-CONH(C_1\text{-}C_4)$alkyl eller $-COO(C_1\text{-}C_4)$alkyl,
R^8 er -CN, $-SO_2(C_1\text{-}C_4)$alkyl eller $-SO_2$.aryl,
R^9 er $-NH_2$, $-NH(C_1\text{-}C_4)$alkyl, -NH.aryl eller $(C_1\text{-}C_4)$-alkoxy,
R^{10} er $-NH_2$, $-N((C_1\text{-}C_4)\text{alkyl})_2$ eller $(C_1\text{-}C_4)$alkyl, og
R^{11} er H, halogenmethyl, $-COO(C_1\text{-}C_4)$alkyl, $-CH_2O(C_1\text{-}C_4)$-alkyl, $-CH_2CO(C_1\text{-}C_4)$alkyl, $(C_1\text{-}C_4)$alkyl, $(C_1\text{-}C_4)$-alkoxy, aryl, heteroaryl, morpholino eller 5-oxo-pyrrolidin-2-yl, eller syreadditionssalte deraf fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.
Forbindelserne er nyttige som anti-ischæmiske og anti-hypertensive midler.