

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING⁽¹⁰⁾ DK 0212/92 L

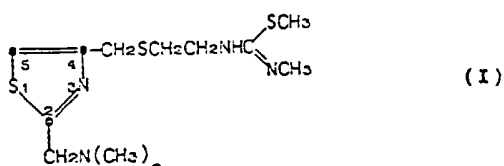
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 0212/92 (51) Int.Cl. 5: C 07 D 277/28
(22) Indleveringsdag:.... 19 feb 1992
(24) Løbedag:..... 06 feb 1984
(41) Alm. tilgængelig:.... 19 feb 1992
(62) Stamansøgningsnummer:..... 0519/84
(86) International ansøgning nr.:... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 07 feb 1983 US 464296
(71) Ansøger: *Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center; Indianapolis; Indiana 46285, US
(72) Opfinder: Charles Wilbur *Ryan, 606 Debra Lane; Indianapolis; Indiana 46217, US
(4) Fuldmægtig: Hofman-Bang & Boutard A/S, Adelgade 15, 1304, København K

- (54) Isothiourinstof-derivat og fremgangsmåde til fremstilling deraf
(57) Sammen drag

212-92

Det hidtil ukendte isothiourinstof-derivat med formlen



fremstillet ved, at man omsætter 2-dimethylaminomethyl-4-(2-aminoethyl)thiomethylthiazol med dimethylesteren af methylcarbonimidodithiosyre i nærværelse af mindst ca. 1 mol af en syre pr. mol af thiazolen, fortrinsvis i et vandigt eller vandigt-alkanolisk medium ved en pH-værdi på omkring 5-7.

Isothiourinstof-derivatet (I) anvendes til fremstilling af H_2 -receptor-inhibitoren nizatidin (N-methyl-N'-[2-(2-dimethylthiazol-4-ylmethylthio)-ethyl]-2-nitro-1,1-ethendiamin) ved omsætning med nitromethan, hvorved nizatidin opnås i høje udbytter og med høj renhed.