

C 07 D 471

Ans.nr.: 1926/83

Indleveret: 28 apr 1983

Løbedag: 28 apr 1983

Alm. tilgængelig: 30 okt 1983

Prioritet: 29 apr 1982 GB 8212429

06 apr 1983 GB 8309259

*FARMITALIA CARLO ERBA S.P.A.; Milano, IT.

Opfinder: Gianfederico *Doria; IT, Carlo *Passarotti; IT, Pier Paolo *Lovisolio; IT, Ada *Buttinoni; IT.

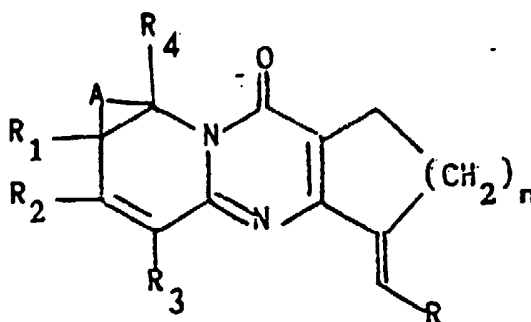
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Fremgangsmåde til fremstilling af kondenserede cycloaliphatiske derivater af substituerede (1,2-a)pyrimidiner

H A M M E N D R A G

1926-83

Kondenserede cycloaliphatiske derivater af substituerede (1,2-a)pyrimidiner med formlen



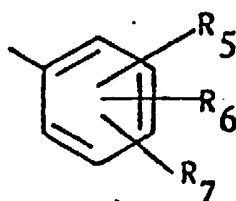
hvor n er 1 eller 2,

R_1 er et hydrogen- eller et halogenatom, en C_{1-4} -alkyl-, en -CN-, en -CONH₂-gruppe eller en -COOR₈-gruppe, hvor R₈ er hydrogen eller en C_{1-6} -alkyl gruppe, der eventuelt er substitueret med di-(C_{1-4})-alkylamino,

R_2 , R_3 og R_4 hver er et hydrogen- eller et halogenatom, en C_{1-4} -alkyl-, en C_{1-4} -alkoxy- eller en C_{3-4} -alkenyl-oxygruppe,

A kompletterer en binding, hvorved der fås en dobbelt-binding eller, når R_1 er $-\text{COOR}_8$, hvor R_8 har den ovenfor anførte betydning, kan A også være en $-\text{CH}_2$ -grupoe, hvorved der fås en cyclopropanring annelleret til pyridoringen,

R er a) furyl, thienyl eller pyridyl eller
b) en gruppe med formlen

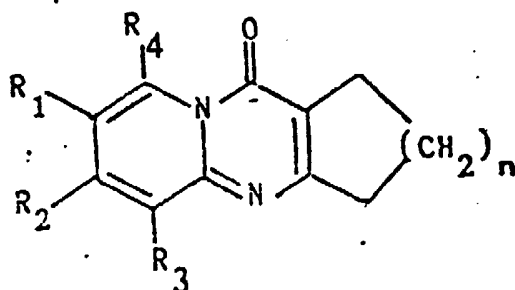


hvor R_5 , R_6 og R_7 hver er et hydrogen- eller et halogenatom, hydroxy, formyloxy, C_{2-8} -alkanyloxy, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoxy, nitro eller

en $-\text{N} \begin{smallmatrix} \text{R}_9 \\ \text{R}_{10} \end{smallmatrix}$ -gruppe, hvor R_9 og R_{10} hver er

hydrogen, C_{1-4} -alkyl, formyl eller C_{2-8} -alkanoyl, eller ved siden af hinanden liggende grupper gengivet ved to af symbolerne R_5 , R_6 og R_7 danner tilsammen en C_{1-3} -alkylendioxygruppe,

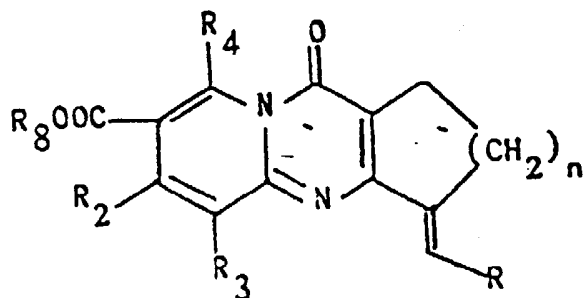
eller pharmaceutisk acceptable salte deraf, fremstilles ved, at
a) en forbindelse med formlen



II

eller et salt deraf omsættes med et aldehyd med formlen III
 $\text{R}-\text{CHO}$, eller

b) en forbindelse med formlen



IV

cyclopropaneres.

Forbindelserne med formlen I er anvendelige til forebyggelse og behandling af alle sygdomme, hvori inflammatoriske og/eller anaphylaktiske udløsere er indblandet, f.eks. allergiske lidelser og inflammatoriske sygdomme. Forbindelserne er endvidere anvendelige til behandling af f.eks. rheumatoid osteoarthritis og osteoarthrosis. Forbindelserne er også aktive i det gastroenteriske system, idet de især har anti-ulcerogen og antisekretorisk virkning og kan således anvendes til behandling og forebyggelse af peptisk ulcus.

