

C 07 D 239

Ans.nr.: 4681/84

Indleveret: 28 sep 1984

Løbedag: 28 sep 1984

Alm. tilgængelig: 30 mar 1985

Prioritet: 29 sep 1983 US 537232

02 jul 1984 US 627139

\*ORTHO PHARMACEUTICAL CORPORATION; Raritan, US.

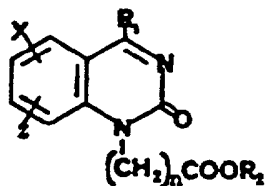
Opfinder: Ramesh M. \*Kanojia; US, Victor T. \*Bandurco; US, Seymour D. \*Levine; US, Alfonso J. \*Tobia; US, Dennis M. \*Mulvey; US.

Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S  
Fremgangsmåde til fremstilling af substituerede 4-alkyl-2(1H)-quinazolinon-1-alkansyrederivater

SAMMENDRAG

4681-84

Quinazolin-2-on-derivater med formlen:



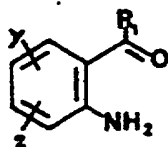
hvor

n er et heltal fra 2 til 6,

$R_1$  er lavere alkyl,

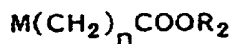
$R_2$  er hydrogen eller lavere alkyl, og

Y og Z er hydrogen eller lavere alkoxy, forudsat at Y og Z ikke begge samtidig er hydroxy i 5,6 eller 6,7 stillingerne, samt farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf, fremstilles ved at man omsætter en forbindelse med formlen:

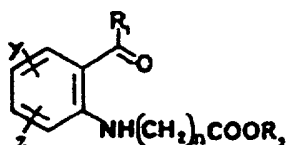


4a

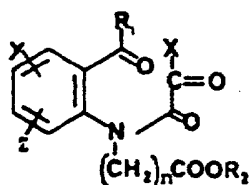
med et alkyleringsmiddel med formlen:



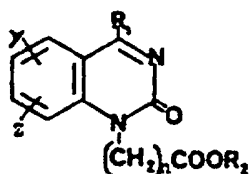
til dannelse af en forbindelse med formlen:



omsætter den dannede sekundære anilinoforbindelse med et oxalylhalogenid til dannelse af en forbindelse med formlen:



og omsætter det dannede oxamylhalogenid med natriumazid til dannelse af en quinazolinon med formlen:



idet i de ovenstående formler,  $n$  er et heltal fra 2 til 6,  $R_1$  er lavere alkyl,  $R_2$  er lavere alkyl,  $Y$  og  $Z$  er lavere alkoxy,  $X$  er chlor eller brom, og  $M$  er halogen, tosyl eller mesyl. Visse af de fremstillede quinazolinon-2-on-derivater er hidtil ukendte og kan anvendes som cardiovaskulære midler.