

C 07 C 127

Ans.nr.: 0286/83

Indleveret: 25 jan 1983

Løbedag: 25 jan 1983

Alm. tilgængelig: 27 jul 1983

Prioritet: 26 jan 1982 US 342698

26 jan 1982 US 342693

*AMERICAN CYANAMID COMPANY; Wayne, US.

Opfinder: Vern Gordon *Devries; US, Elwood Eugene *Largis; US, Ransom Brown *Conrow; US.

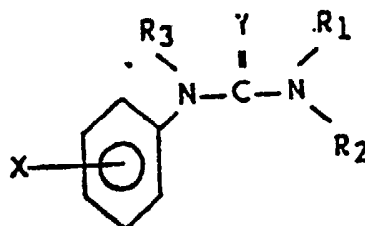
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Fremgangsmåde til fremstilling af substituerede urinstoffer og thiourinstoffer

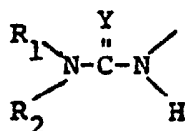
S A M M E N D R A G

286-83

Substituerede urinstof- og thiourinstofforbindelser
med formelen



hvor X er mindst én substituent valgt blandt hydrogen, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkenyl, C₁₋₄-alkynyl, hydroxy, C₁₋₄-alkoxy, phenoxy, mercapto, C₁₋₄-alkylthio, amino, C₁₋₄-alkylamino, di-(C₁₋₄-alkyl)amino, halogen, trihalogenmethyl, C₁₋₄-alkanoyl, benzoyl, C₁₋₄-alkan-amido, C₁₋₄-alkansulfonyl, C₁₋₄-alkansulfinyl, benzensulfonyl, toluensulfonyl, nitro, cyano, carboxy, C₁₋₄-carboalkoxy, carbamoyl, sulfamyl, methylenedioxy, phenyl, ortho-phenylen, tolyl, benzyl, halogenbenzyl, methylbenzyl og gruppen



Y er oxygen eller svovl,

R₁ og R₂ er ens eller forskellige og er hver valgt blandt C₄₋₁₂-alkyl, C₄₋₁₂-alkenyl, C₄₋₁₂-alkynyl, C₄₋₁₂-cycloalkyl, C₄₋₁₂-cycloalkylalkyl, C₇₋₁₄-aralkyl og C₇₋₁₄-aralkyl, hvor en aromatisk ring bærer mindst én substituent valgt blandt C₁₋₁₀-alkyl, C₁₋₁₀-alkoxy, phenoxy, benzyloxy, methylenedioxy, C₁₋₄-alkylthio, phenyl, halogen, trihalogenmethyl, adamantyl, C₁₋₄-carboalkoxy og nitro,

R₃ er valgt blandt hydrogen, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkenyl, C₁₋₄-alkynyl, benzyl, benzyl med mindst én substituent Z, naphthyl, phenyl og phenyl med mindst én substituent Z, hvor Z er valgt uafhængigt af X blandt de forbindelser, hvoriblandt X vælges, og når R₃ er hydrogen, kan R₁ og R₂ ikke være det samme,

fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne med formelen I er antisclerotisk aktive, idet de er kraftige inhibitorer af ACAT-enzymet. De er derfor anvendelige til regulering og reduktion af indholdet af cholesterylester i pattedyrs arterievægge og til nedsættelse af akkumulering og oplagring af kolesterol i pattedyrs arterievægge. Desuden inhiberer de dannelse eller udvikling af artherosclerotiske læsioner hos pattedyr.