

C 07 D 277

Ans.nr.: 3436/82

Indleveret: 30 jul 1982

Løbedag: 30 jul 1982

Alm. tilgængelig: 04 feb 1983

Prioritet: 03 aug 1981 US 289352

*BRISTOL-MYERS COMPANY; New York, US.

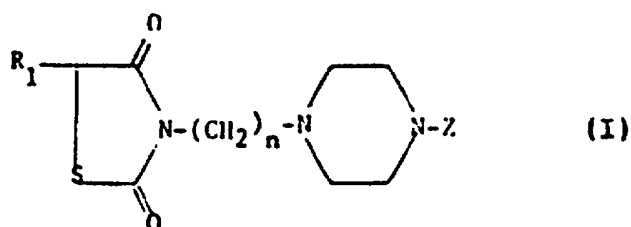
Opfinder: Davis L. *Temple Jr.; US, Richard E. *Yeager; US.

Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S
Fremgangsmåde til fremstilling af
thiazolidinylalkylen-piperazin-derivater

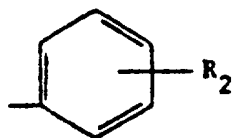
SAMMENDRAG

3436-82

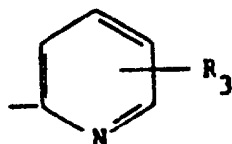
Thiazolidinyl-derivater med formlen (I)



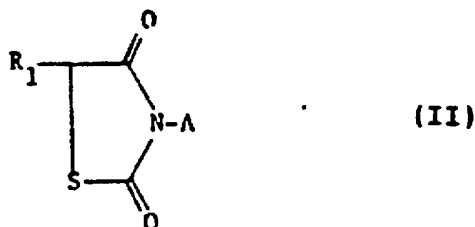
hvor R_1 betegner lavere alkyl eller hydrogen, n er det hele tal 2 til 5, Z betegner en R_2 -substitueret phenylgruppe med formlen



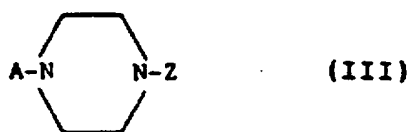
hvor R_2 betegner hydrogen, halogen, lavere alkyl, lavere alkoxy eller trifluormethyl, under forudsætning af, at når n er 3, 4 eller 5, er Z også 2-pyrimidinyl eller en R_3 -substitueret 2-pyridinyl-gruppe med formlen



hvor R_3 betegner hydrogen eller cyano, eller et farmaceutisk acceptabelt, non-toxisk syreadditionssalt deraf, KENDETEGNET ved, AT man omsætter en thiazolidindion med formel (II)



hvor A uafhængigt betegner hydrogen, et alkalimetalsalt eller gruppen $X-(CH_2)_4-$, hvor X er syreresten af en reaktiv ester-gruppe og n og R_1 har de ovenfor anførte betydninger med en piperazin med formel (III)



hvor A og Z har de ovenfor anførte betydninger, i et for reaktionen inert medium med eller uden en base ved en temperatur fra ca. 50°C til ca. 200°C i et tidsrum, som er tilstrækkeligt til at give den resulterende forbindelse med formel (I) og/eller om ønsket omdanner den resulterende forbindelse med formel (I) til et salt eller et resulterende salt omdannes til den frie forbindelse eller til et andet salt.

Forbindelserne (I) har selektiv anxiolytisk aktivitet.