

C 07 D 231

Ans.nr.: 3723/82

Indleveret: 19 aug 1982

Løbedag: 19 aug 1982

Alm. tilgængelig: 21 feb 1983

Prioritet: 20 aug 1981 DE 3132915

*KALI-CHEMIE PHARMA GMBH; Hannover, DE.

Opfinder: Henning *Heinemann; DE, Daniel *Jasserand; FR, Wolfgang *Milkowski; DE, Dimitri *Yavordios; FR.

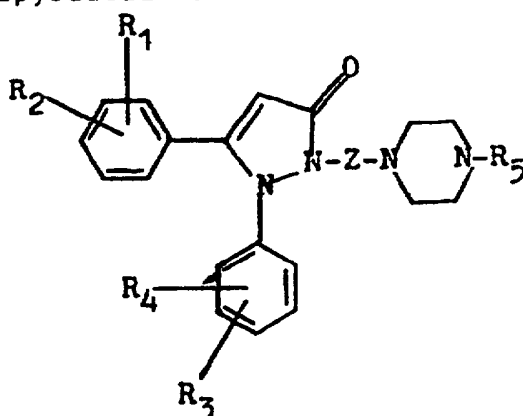
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af 1,5-diphenylpyrazolin-3-on-forbindelser eller syreadditionssalte deraf og mellemprodukter herved

SAMMENDRAG

3723-82

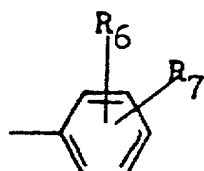
1,5-Diphenylpyrazolin-3-on-forbindelser med formel I



I

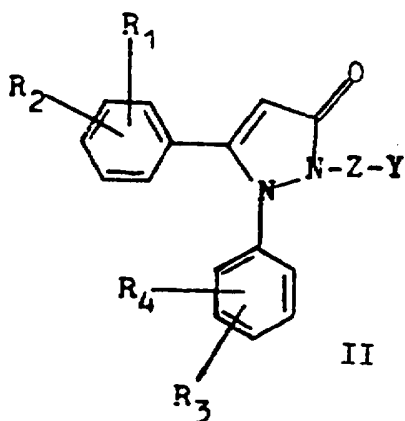
hvor R_1 er H, alkyl, alkoxy, hydroxy, halogen, trifluormethyl eller alkanoyloxy, R_2 er H, alkyl, alkoxy, halogen, eller R_1 og R_2 er sammen med de nabostillede carbonatomer alkylendioxy, R_3 er H, alkyl, alkoxy, hydroxy, halogen, trifluormethyl eller alkanoyloxy, R_4 er H, alkyl, alkoxy eller halogen, eller R_3 og R_4 er sammen med de nabostillede carbonatomer alkylendioxy, Z er alkylen, R_5 er eventuelt alkyl-, halogen eller alkoxy monosubstitueret pyridyl,

thienyl eller en eventuelt substitueret phenylgruppe a

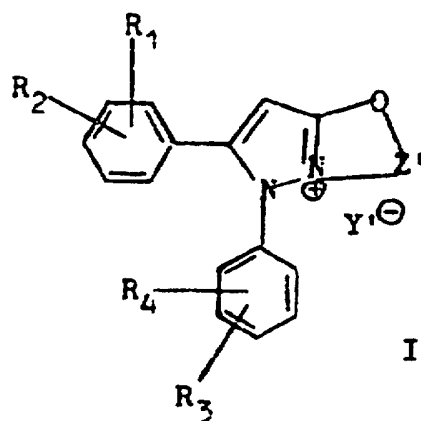


a

hvor R_6 er H, alkyl, alkoxy, hydroxy, halogen, trifluormethyl eller alkanoyloxy, R_7 er H, alkyl, alkoxy eller halogen, eller R_6 og R_7 er sammen med de nabostillede carbonatomer alkylendioxy, eller syreadditionssalte heraf fremstilles ved omsætning af forbindelser med formel II eller III

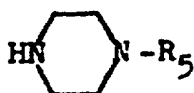


II



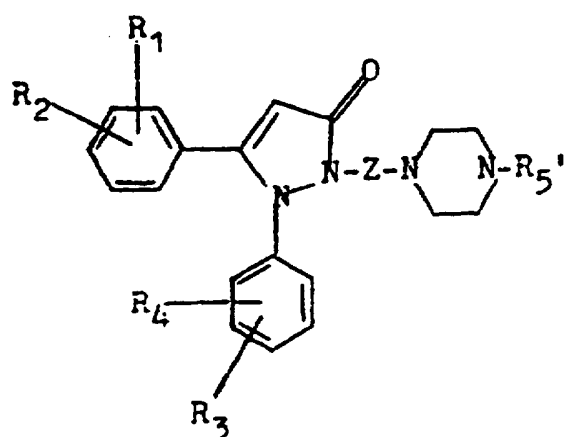
III

hvor R_1 , R_2 , R_3 , R_4 og Z er som ovenfor, Y er en aminolytisk fraspaltelig gruppe, eller Z' er en alkylenkæde, og Y' er halogen, eller blandinger heraf omsættes med forbindelser med formel V



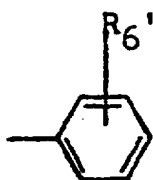
V

hvor R_5 er som ovenfor, eller til fremstilling af forbindelser med formel Ia

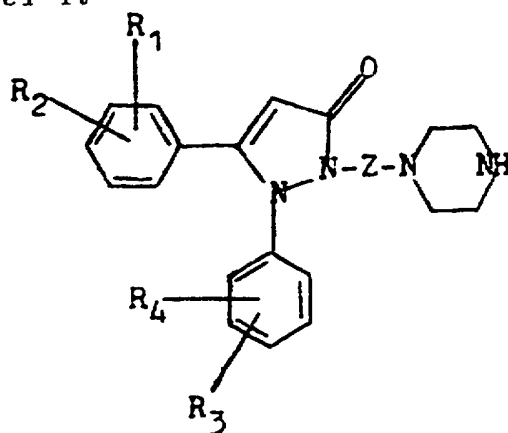


Ia

hvor R_1 , R_2 , R_3 , R_4 og Z er som ovenfor, og R_5 er en substitueret phenylgruppe a' ,

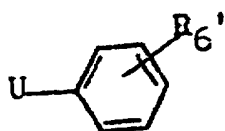
 a'

hvor R_6' er i ortho- eller parastilling og CF_3 , forbindelser med formel IV



IV

hvor R_1 , R_2 , R_3 , R_4 og Z er som ovenfor, omsættes med forbindelser med formel VI



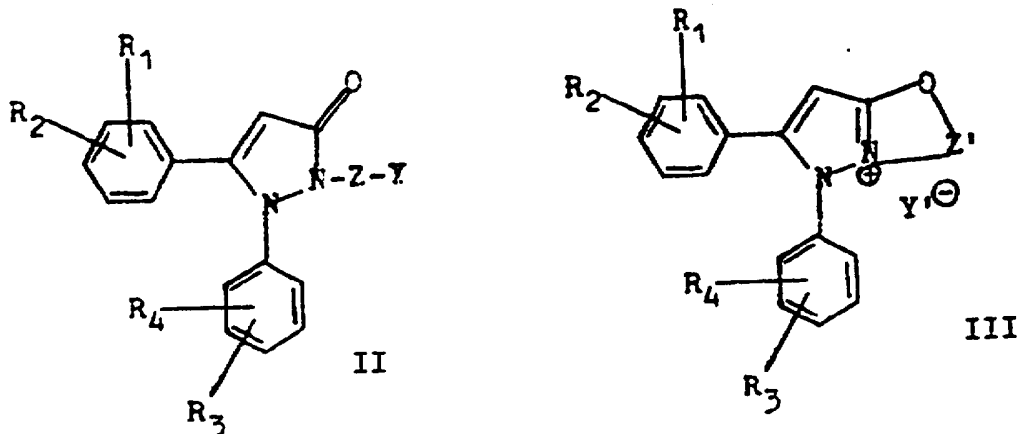
VI

hvor R_6' er som ovenfor, og U er halogen, hvorefter der eventuelt overføres til syreadditionssalte eller syreadditionssalte omdannes til de frie forbindelser I.

a

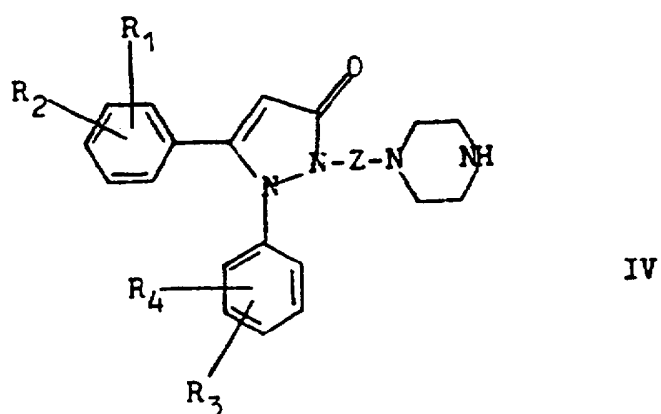
Forbindelserne er lægemidler med antiallergisk virkning.

Forbindelserne II eller III



hvor R_1 , R_2 , R_3 , R_4 og Z er som ovenfor, Y er en aminolytisk fraspaltelig gruppe, Z' er en alkylenkæde, og Y' er halogen.

Forbindelserne med formel IV



hvor R_1 , R_2 , R_3 , R_4 og Z er som ovenfor.

Forbindelserne II, III og IV er mellemprodukter.