



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	914923
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07D 471/14 // (C 07D 471/14, 221:00, 243:00, 221:00)	
(22) Hakempäivä - Ansökningsdag	18.10.91
(24) Alkupäivä - Löpdag	18.10.91
(41) Tulnut julkiseksi - Blivit offentlig	20.04.92
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
19.10.90 US 600451 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Boehringer Ingelheim Pharmaceuticals, Inc., 90 East Ridge, P.O. Box 368, Ridgefield, Conn. 06877, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Grozinger, Karl G., 171 High Ridge, Ridgefield, Conn., USA, (US)
2. Hargrave, Karl D., 4 Edna Drive, Brookfield, Conn. 06805, USA, (US)
3. Adams, Julian, 270 Peaceable Street, Ridgefield, Conn. 06877, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Menetelmä valmistaa 5,11-dihydro-6H-dipyrido-/3,2-b:2',3'-e//1,4/diatsepiineja
Förfarande för framställning av 5,11-dihydro-6H-dipyrido-/3,2-b:2',3'-e//1,4/diazepiner

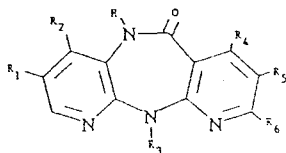
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Menetelmä valmistaa tiettyjä 5,11-dihydro-6H-dipyrido[3,2-b:2',3'-e][1,4]diatsepiineja, joka käsittää seuraavat vaiheet:

1. muunnetaan 2,6-dikloori-3-pyridiini-karboksamidiksi 2,6-dikloori-3-aminopyridiiniä Hoffmann'in uudellenjärjestäytymisellä.
2. saatetaan 2,6-dikloori-3-aminopyridiini reagoimaan 2-kloorinikotiinihapon kanssa, jolloin saadaan 2,6-dikloori-3-(2'-kloori-3'-nikotinyyli)karboksamidopyridiini;
3. saatetaan 2,6-dikloori-3-(2'-kloori-3'-nikotinyyli)karboksamidopyridiini reagoimaan amiinin kanssa, jolloin saadaan 2,6-dikloori-3-(2'-amino-3'-nikotinyyli)karboksamidopyridiini; ja
4. hydrataan 2,6-dikloori-3-(2'-amino-3'-nikotinyyli)karboksamidopyridiini, jolloin saadaan 5,11-dihydro-6H-dipyrido[3,2-b:2',3'-e][1,4]diatsepiini

Förfarande för framställning av vissa 5,11-dihydro-6H-dipyrido[3,2-b:2',3'-e][1,4]diazepiner, som består av följande steg:

1. 2,6-diklor-3-pyridin-karboxamid omvandlas till 2,6-diklor-3-aminopyridin med Hoffmann's rearrangemang.
2. 2,6-diklor-3-aminopyridin omsätts med 2-klor-nikotinsyra, varvid 2,6-diklor-3-(2'-klor-3'-nikotinyli)karboxamidopyridin erhålls;
3. 2,6-diklor-3-(2'-klor-3'-nikotinyli)karboxamidopyridin omsätts med en amin, varvid 2,6-diklor-3-(2'-amino-3'-nikotinyli)karboxamidopyridin erhålls; och
4. 2,6-diklor-3-(2'-amino-3'-nikotinyli)karboxamidopyridin hydreras, varvid 5,11-dihydro-6H-dipyrido[3,2-b:2',3'-e][1,4]-diazepin erhålls.



(1)