

C 07 D 207

Ans.nr.: 0665/84

Indleveret: 14 feb 1984

Løbedag: 14 feb 1984

Alm. tilgængelig: 15 aug 1985

Prioritet: -

\*WARNER-LAMBERT COMPANY; Morris Plains, US.

Opfinder: Donald Eugene \*Butler; US.

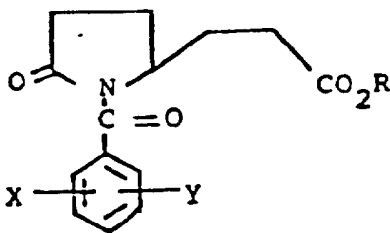
Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

1-Aroyl-5-oxo-2-pyrrolidinpropansyrer samt  
beslægtede estere

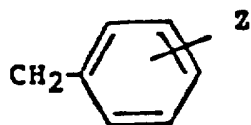
SAMMENDRAG

665-84

1-Aroyl-5-oxo-2-pyrrolidinpropansyrer med formlen:



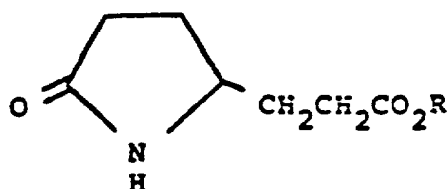
hvor R er en farmaceutisk acceptabel metal- eller amin-  
kation, hydrogen, alkyl eller



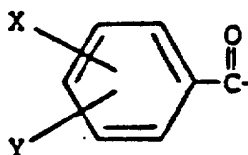
hvor Z er hydrogen, alkyl, fluor, chlor, brom eller tri-  
fluormethyl,

X og Y er hydrogen, chlor, fluor, hydroxy, amino, alkylamino, dialkylamino,  $(\text{CH}_2)_n\text{N}-$ , hvor n er et heltal fra 3 til 7, alkyl, alkoxy med fra 1-6 carbonatomer eller benzyloxy, hvori X og Y kan være ens eller forskellige og, når X og Y ligger på nabocarbonatomer, sammen inkluderer gruppen  $-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}$  eller  $\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$  med det forbehold, at såfremt R er hydrogen eller en farmaceutisk acceptabel metal- eller aminkation, er X en substituent forskellig fra hydrogen, farmaceutisk acceptable salte og estere deraf, er anvendelige som aktive ingredienser i farmaceutiske præparater ved senilitetsbehandling, hvorved motivationen hos dårligt fungerende personer forbedres, og amnesia afhjælpes.

Forbindelserne, bortset fra hvor X og Y er amino og alkylamino, fremstilles ved at omsætte en forbindelse med formlen III



med et aktiveret aroyleringsmiddel med formlen IV



hvor hal er F, Cl eller Br, i nærværelse af en syreaccepterende base såsom pyridin eller en trialkylamin. Forbindelserne, hvori X og Y er amino og alkylamino, fremstilles ud fra den tilsvarende nitroforbindelse ved katalytisk hydrogenering.