

C 07 D 513

Ans.nr.: 4984/83

Indleveret: 31 okt 1983

Løbedag: 31 okt 1983

Alm. tilgængelig: 02 maj 1984

Prioritet: 01 nov 1982 US 438079

27 jul 1983 US 517612

*JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.; Beerse, BE.

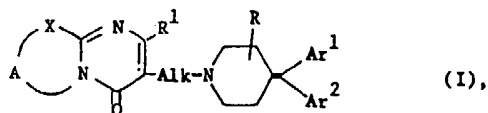
Opfinder: Ludo Edmond Josephine *Kennis; BE, Jan *Vandenberk; BE, Josephus Carolus *Mertens; BE.

Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S
((Bis(aryl)methylen)-1-piperidinyl)alkyl-pyrimidinoner og fremgangsmåde til fremstilling deraf

SAMMENDRAG

4984-83

[[Bis(aryl)methylen]-1-piperidinyl]alkyl-pyrimidinoner med formelen



de mulige stereokemiske isomere former og farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf, hvori

R er hydrogen, hydroxy eller lavere alkyloxy,

R¹ er udvalgt fra gruppen bestående af hydrogen og lavere alkyl,

Alk er en lavere alkandylgruppe,

X er udvalgt fra gruppen bestående af -S-, -CH₂- og -C(R²)=C(R³)-, idet R² og R³ hver for sig og uafhængigt af hinanden betegner hydrogen eller lavere alkyl,

A er en bivalent gruppe med formelen -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- eller $\begin{matrix} \text{C} & \text{C} \\ | & | \\ \text{R}^4 & \text{R}^5 \end{matrix}$, hvori R⁴ og R⁵ hver for sig og uaf-

10a

hængigt af hinanden er udvalgt fra gruppen bestående af hydrogen, halogen, amino og lavere alkyl, og

Ar^1 og Ar^2 hver for sig og uafhængigt af hinanden er udvalgt fra gruppen bestående af pyridinyl, thienyl og phenyl, eventuelt substitueret med halogen, hydroxy, lavere alkyloxy, lavere alkyl og trifluormethyl,

fremstilles ved hjælp af forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne (I) besidder nyttige serotonin-antagonistiske egenskaber.