

C 07 C 103/52

Ans.nr.: 3975/83

Indleveret: 31 aug 1983

Løbedag: 31 aug 1983

Alm. tilgængelig: 02 mar 1984

Prioritet: 01 sep 1982 US 413786

E.I. DU *PONT DE NEMOURS AND COMPAN-
NY; Wilmington, US.

Opfinder: Alexander Lawrence *Johnson; US.

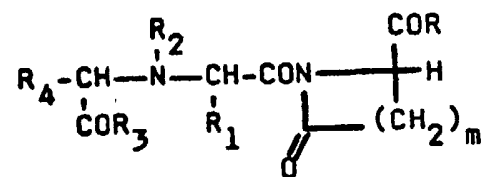
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou &
Co

Fremgangsmåde til fremstilling af 1-substi-
tuerede cycliske lactam-2-carboxylsyrer eller
derivater deraf

SAMMENDRAG.

3975-83

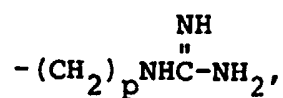
1-Substituerede cycliske lactam-2-carboxylsyrer eller deres
derivater med formlen



i hvilken

R og R₃ hver for sig betyder OH, C₁-C₄-alkoxy eller C₆H₅-CH₂O,

R₁ betyder H, CH₃, C₂H₅, CF₃, isobutyl, isoamyl, -(CH₂)_n-NHR₅ eller



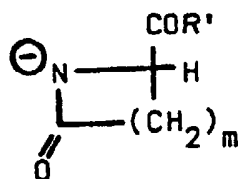
R₂ betyder H eller CH₃,

R₄ betyder C₁-C₁₀-alkyl, -(CH₂)_qC₆H₅ eller -(CH₂)_rNH₂,

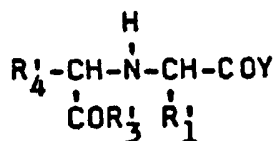
R₅ betyder H eller C₁-C₄-alkyl,

m er 2, 3 eller 4,

n er et helt tal fra 1 til 6,
 p er et helt tal fra 1 til 6,
 q er et helt tal fra 0 til 6, og
 r er et helt tal fra 1 til 6, fremstilles ved, at man
 (a) kobler en anion med formlen



i hvilken R' betyder OX, C₁-C₄-alkoxy eller benzyloxy, og
 m har den ovenfor angivne betydning, med en amino-disyre
 med formlen



i hvilken

R₁' betyder H, CH₃, C₂H₅, CF₃, isobutyl, isoamyl, (CH₂)_n-
 NR₅-X¹ eller (CH₂)_pNH-C(=NH)NH-X²,

R₃' betyder OX³, C₁-C₄-alkoxy eller benzyloxy,

R₄' betyder C₁-C₁₀-alkyl, -(CH₂)_qC₆H₅ eller (CH₂)_rNH-R₄,

R₅, n, p, q og r har den ovenfor angivne betydning,

X, X¹, X², X³ og X⁴ er beskyttelsesgrupper, og

Y er en carboxyl-aktiverende gruppe,

til fremstilling af en forbindelse i hvilken R₂=H,

(b) eventuelt methylerer produktet fra trin (a) til frem-
 stilling af en forbindelse, i hvilken R₂=CH₃, og

(c) fjerner de nødvendige beskyttelsesgrupper til fremstil-
 ling af det ønskede produkt.

De således fremstillede forbindelser har nyttig antihyper-
 tensiv virkning.