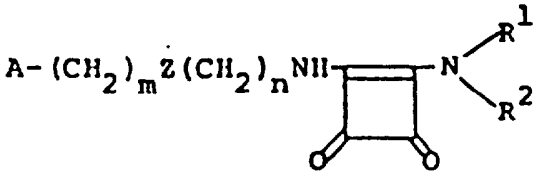
C 07 C 97 Ans.nr.: 2193/82
Indleveret: 14 maj 1982
Løbedag: 14 maj 1982
Alm. tilgængelig: 19 nov 1982
Prioritet: 18 maj 1981 US 264533
*BRISTOL–MYERS COMPANY; New York, US.
Opfinder: Aldo Antonio *Algieri; US, Ronnie Ray *Crenshaw; US.
Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S

Fremgangsmåde til fremstilling af 1,2–diamino-cyclobuten–3,4–dioner

SAMMENDRAG

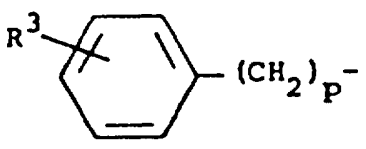
2193-82

Forbindelser med formlen

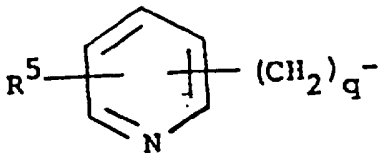


I

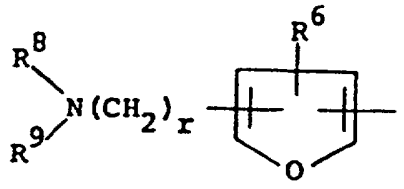
hvori R^1 og R^2, som kan være ens eller forskellige, betegner hydrogen eller (lavere)alkyl, og hvor R^2 endvidere, når R^1 betegner hydrogen, kan være allyl, propargyl, cyclo(lavere)alkyl(lavere)alkyl, cyclo(lavere)alkyl, cyano(lavere)alkyl, 2-fluormethyl, 2,2,2-trifluorethyl, hydroxy, 2,3-dihydroxypropyl,



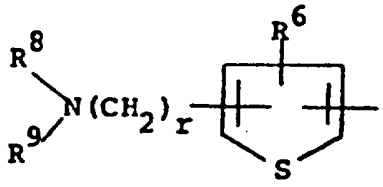
eller

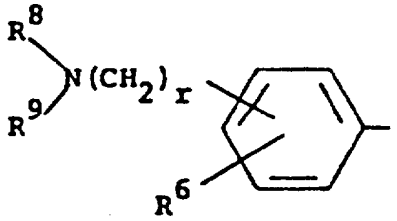


hvori p er et helt tal fra 1 til 6 inklusive, q er et helt tal fra 1 til 6 inklusive, R^3 og R^4, som kan være ens eller forskellige, betegner hydrogen, (lavere)alkyl, hydroxy, (lavere)alkoxy eller halogen, og hvor R^4 endvidere, når R^3 betegner hydrogen, kan være trifluormethyl, eller R^3 og R^4 tilsammen betegner methylendioxy, R^5 betegner hydrogen, (lavere)alkyl, (lavere)alkoxy, hydroxy, amino eller halogen, m er et helt tal fra 0 til 2 inklusive, n er et helt tal fra 2 til 5 inklusive, Z er svovl, oxygen eller methylen, og A betegner

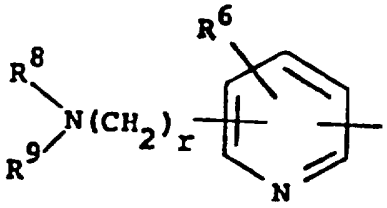


,





eller



hvori R^6 betegner hydrogen, (lavere)alkyl, (lavere)alkoxy eller halogen, r er et helt tal fra 1 til 4 inklusive, og R^8 og R^9, som kan være ens eller forskellige, betegner hydrogen, (lavere)alkyl, allyl, propargyl, (lavere)alkoxy(lavere)alkyl, hvori (lavere)alkoxy-delen er mindst to carbonatomer væk fra nitrogenatomet, cyclo(lavere)alkyl eller phenyl(lavere)alkyl, under den forudsætning, at R^8 og R^9 ikke begge kan være cyclo(lavere)alkyl eller at R^8 og R^9 sammen med nitrogenatomet, hvortil de er bundet, kan være pyrrolidino, methylpyrrolidino, dimethylpyrrolidino, morpholino, thiomorpholino, piperidino, methylpiperidino. dimethylpiperidino, hydroxypiperidino, N-methylpiperazino, 1,2,3,6-tetrahydropyridyl, 3-pyrrolino, homopiperidino, heptamethylenimino, octamethylenimino eller 3-azabicyclo[-3.2.2]-nonan, eller et ikke-toxisk, farmaceutisk acceptabelt salt, hydrat eller solvat deraf, fremstilles ved hjælp af forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne (I) er kraftige histamin H_2-antagonister, der kan anvendes til behandling af peptisk ulcus.