



SUOMI—FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 890065
C 07 D 471/04 // (C 07 D 471/04,
(51) Kv.lk. 4/Int.cl. 4 209:00, 221:00)
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 06.01.89
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 08.07.89
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 07.01.88 GB 8800312

(71) Hakija/Sökande: *Glaxo Group Limited*, Clarges House, 6-12 Clarges Street, London, Iso-Britannia

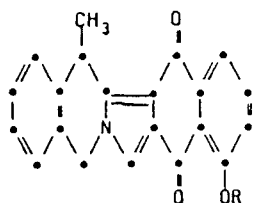
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Phillips, Gordon Hanley 2. Cowley, Brian Richard

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

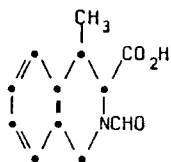
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä 5,8,13,14-tetrahydrobents/5,6/ isoindolo/2,1-b/isokinonliini-8,13-dionijohdannaisten valmistamiseksi. Förfarande för framställning av 5,8,13, 14-tetrahydrobenz/5,6/isoindolo/2,1-b/isokinolin-8,13-dionderivat.

(57) TIIVISTELMÄ

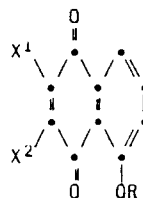
Keksintö koskee menetelmää 5,8,13,14-tetrahydrobents(5,6)isoindolo(2,1-b)isokinonliini-8,3-dijohdannaisten valmistamiseksi, joilla on kaava (1), jossa OR on hydroksyyli, suojattu hydroksyyli tai $OP(O)(OCH_2Ph)(OR^1)$, jossa Ph on fenyyli ja OR^1 on hydroksyyli tai suojattu hydroksyyli, ja niiden suolojen valmistamiseksi. Tässä menetelmässä yhdiste, jolla on kaava (2), saatetaan reagoimaan yhdisteen kanssa, jolla on kaava (3), jossa OR on edellä määriteltä ja toinen radikaaleista X^1 ja X^2 on poistuva ryhmä ja toinen on vetyatomi, tai sen suolan kanssa, ja sen jälkeen haluttaessa poistetaan mahdollinen hydroksyylin suojaryhmä ja/tai muutetaan saatu yhdiste suolaksi. Kaava (1) mukaiset yhdisteet ovat joko kasvainten vastaisia aineita tai käyttökelpoisia välituotteina kasvainten vastaisten aineiden synteesissä.



(1)



(2)



(3)

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av 5,8,13,14-tetrahydrobenz (5,6)isoindolo(2,1-b)isokinolin-8,3-dionderivat med formeln (I), vari OR är hydroxyl, skyddad hydroxyl eller $OP(O)(OCH_2Ph)(OR^1)$, vari Ph är fenyl och OR^1 är hydroxyl eller skyddad hydroxyl, samt av salt därav. Enligt detta förfarande omsätts en förening med formeln (2) med en förening med formeln (3), vari OR är som ovan definierats och någondera av X^1 och X^2 är en avgående grupp och den andra är en väteatom, eller med ett salt därav, varefter, ifall önskvärt, hydroxylskyddsgruppen avlägsnas ifall den är närvarande, och/eller saltet bildas. Föreningarna med formeln (I) bildar antingen antikancermedel eller mellanprodukter, vilka kan användas vid syntesen av antikancermedel.