

(12) PATENTANSØGNING⁽¹⁰⁾ DK 1376/90 A

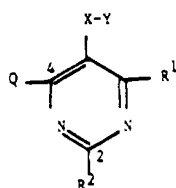
Patentdirektoratet

- | | |
|--|--------------------------------|
| (21) Patentansøgning nr. : 1376/90 | (51) Int. Cl. 5: C 07 D 239/26 |
| (22) Indleveringsdag:.... 01 jun 1990 | C 07 D 239/42 |
| (24) Løbedag:..... 06 mar 1989 | C 07 D 401/04 |
| (41) Alm. tilgængelig:.... 01 jun 1990 | C 07 D 405/04 |
| (62) Stamansøgningsnummer:..... | C 07 D 401/04 |
| (86) International ansøgning nr. :... PCT/EP89/00225 | C 07 D 213:00 |
| (86) International indleveringsdag: 06 mar 1989 | C 07 D 239:00 |
| (85) Videreførselsdag: 01 jun 1990 | C 07 D 405/04 |
| | C 07 D 239:00 |
| | C 07 D 309:00 |
- (30) Prioritet: 06 okt 1988 US 254514
- (71) Ansøger: *Sandoz AG, Lichtstrasse 35; CH-4002 Basel, CH
- (72) Opfinder: Faizulla Gulamhusein *Kathawala, 39 Woodland Avenue; N.J. 07946, US
- (74) Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau, Sankt Annæ Plads 11, 1250, København K

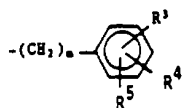
- (54) Pyrimidinyl-substituerede hydroxysyrer, lactoner og estere
- (57) Sammendrag

1376-90

Forbindelser med formelen I



I

hvor
entenR¹ og R² uafhængigt af hinanden er:C₁₋₆-alkyl, der ikke indeholder et asymmetrisk
carbonatom;C₃₋₇-cycloalkyl; eller

hvor

m betegner tallet 0, 1, 2 eller 3;

R³ er hydrogen, C₁₋₃-alkyl, n-butyl, i-butyl, t-butyl, C₁₋₃-alkoxy, n-butoxy, i-butoxy, trifluormethyl, fluor, chlor, phenoxy eller benzyloxy;

fortsættes

R^4 er hydrogen, C_{1-3} -alkyl, C_{1-3} -alkoxy, trifluoromethyl, fluor, chlor, phenoxy eller benzyl-
oxy; og

R^5 er hydrogen, C_{1-2} -alkyl, C_{1-2} -alkoxy, fluor eller chlor;

med de forbehold, at

- ikke flere end ét af symbolerne R^3 og R^4 er trifluormethyl;
- ikke flere end ét af symbolerne R^3 og R^4 er phenoxy; og
- ikke flere end ét af symbolerne R^3 og R^4 er benzyloxy;

eller

R^1 har den ovenfor anførte betydning, og

R^2 er: benzyloxy;

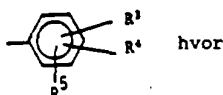
benzylthio;

$-N(R^8)_2$, hvor enten hvert symbol R^8 uafhængigt af hinanden er C_{1-4} -alkyl, der ikke indeholder et asymmetrisk carbonatom, eller begge symboler R^8 sammen med nitrogenatomet danner en del af en 5-, 6- eller 7-leddet eventuelt substitueret ring, der eventuelt indeholder ét eller flere yderligere heteroatomer (ring B); eller
Q, hvor Q er som defineret nedenfor;

Q er Q' eller Q'' , hvor

Q' er en heterocyklisk gruppe, der eventuelt er mono- eller uafhængigt disubstitueret med C_{1-2} -alkyl eller C_{1-2} -alkoxy, og

Q'' er enten Q''_a , hvor Q''_a er



R^3 , R^4 og R^5 har de ovenfor anførte betydninger, herunder de tilhørende forbehold,

eller Q''_b , hvor Q''_b er



R^4 og R^5 har de ovenfor anførte betydninger;

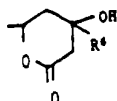
X er enten ethylen eller vinylen; og

Y er: en gruppe Y' med formlen
$$\begin{array}{c} R^6 \\ | \\ -CHCH_2CCH_2COOR^7 \\ | \quad | \\ OH \quad OH \end{array}$$
 hvor

R^6 er hydrogen eller C_{1-3} -alkyl; og

R^7 er hydrogen, en estergruppe ($R^{7'}$) eller en kation (M);

en gruppe Y'' med formlen



hvor R^6 har den ovenfor anførte betydning; eller

1376-90

en gruppe Y'' med formlen
$$\begin{array}{c} \text{R}^6 \\ | \\ -\text{CCH}_2\text{CCH}_2\text{COOR}^7 \\ || \quad | \\ \text{O} \quad \text{OR} \end{array}$$

hvor R⁶ og R⁷ har de ovenfor anførte betydninger;

med det forbehold, at, når Y er en gruppe Y'', er X vinylen, og/eller R⁶ er C₁₋₃-alkyl,

i fri syreform eller i form af en ester eller en δ-lacton deraf eller, hvor det er hensigtsmæssigt, i saltform.

Forbindelserne er egnede til anvendelse som hypolipoproteinæmiske og anti-aterosklerotiske midler. De kan vindes ved reduktion, hydrolyse, afbeskyttelse eller oxidation af egnede udgangsforbindelser og kan omdannes til hinanden ved fx hydrolyse, saltdannelse, esterificering og/eller lactonisering.