

C 07 D 227

Ans.nr.: 5325/82

Indleveret: 30 nov 1982

Løbedag: 30 nov 1982

Alm. tilgængelig: 03 jun 1983

Prioritet: 02 dec 1981 GB 8136364

16 jul 1982 GB 8220721

JOHN *WYETH & BROTHER LIMITED; Maidenhead, GB.

Opfinder: Robin Gerald *Shepherd; GB.

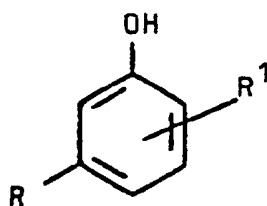
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Fremgangsmåde til fremstilling af m-hydroxyphenyl-substituerede forbindelser

S A M M E N D R A G

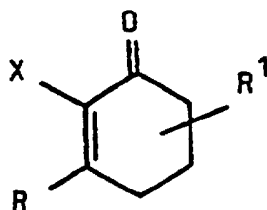
5325-82

m-Hydroxyphenyl-substituerede forbindelser med
formlen



I

hvor R er en organisk gruppe, og
R¹ er hydrogen eller en organisk gruppe,
fremstilles ved, at en forbindelse med formlen



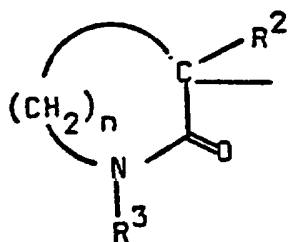
II

hvor X er chlor eller brom, dehydrohalogeneres i nærvær af en stærk nucleophil syrekatalysator.

Fremgangsmåden kan udføres ved omgivelsernes temperatur og har yderligere den fordel frem for gængse aromatiseringsmetoder, at den benytter milde betingelser og undgår anvendelse af brom, der i teknisk målestok er vanskeligt at håndtere og let giver overbromerede produkter, og endelig kan udgangsmaterialerne som regel let isoleres.

Forbindelserne med formlen I er mellemprodukter ved fremstilling af analgetika, anti-inflammatoriske forbindelser eller selektive dopamin-autoreceptoragonister til behandling af forstyrrelser i central-dopamin-autoreceptor-transmissionen eller har i sig selv analgetisk eller anti-inflammatorisk virkning.

Forbindelserne med formlen II, der er mellemprodukter ved fremgangsmåden, og hvor R har formlen



III

hvor n er 2, 3 eller 4, R^2 er hydrogen eller lavere alkyl, og R^3 er hydrogen, lavere alkyl, lavere alkenyl, lavere alkynyl, cycloalkyl(lavere)alkyl eller aryl(lavere)alkyl, er hidtil ukendte forbindelser.