

C 07 D 223

Ans.nr.: 3393/83

Indleveret: 25 jul 1983

Løbedag: 25 jul 1983

Alm. tilgængelig: 30 jan 1984

Prioritet: 29 jul 1982 US 403229

*SMITHKLINE BECKMAN CORPORATION;
Philadelphia, US.

Opfinder: Robert Michael *DeMarinis; US.

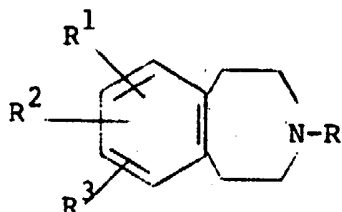
Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

Fremgangsmåde til fremstilling af allyloxy- og
allylthio-2,3,4,5-tetrahydro-1H-3-benzaze-
piner

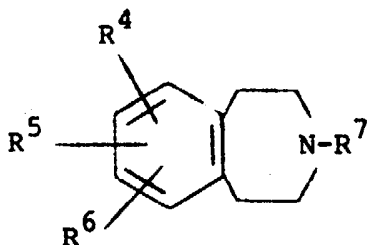
SAMMENDRAG

3393-83

Allyloxy- og allylthio-2,3,4,5-tetrahydro-1H-3-benzazepiner
med formlen:



hvor R er hydrogen eller en lavere alkylgruppe med 1-6 carbonatomer, og R¹, R² og R³ er allyloxy, allylthio, halogen eller hydrogen, med det forbehold, at en af grupperne R¹, R² og R³ er allyloxy eller allylthio, eller et farmaceutisk acceptabelt syreadditionssalt deraf, fremstilles ved, at et allylhalogenid i nærværelse af et syrebindende middel i et opløsningsmiddel omsættes med en forbindelse med strukturformlen:



hvor R^4 er hydroxy eller thiol, R^5 og R^6 er hydrogen, fluor, chlor eller brom, og R^7 er lavere alkyl eller en N-beskyttelsesgruppe, hvorpå man eventuelt fjerner N-beskyttelsesgruppen, hvis den er til stede, ved hjælp af kemiske standardmetoder, og eventuelt danner et syreadditionssalt deraf.

Forbindelserne kan anvendes som α_2 -antagonister og som mellemprodukter til fremstilling af α_2 -adrenergiske affinitetsharpikser.