

C 07 D 311

Ans.nr.: 5770/84

Indleveret: 04 dec 1984

Løbedag: 04 dec 1984

Alm. tilgængelig: 06 jun 1985

Prioritet: 05 dec 1983 US 558081

*JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.; Beerse, BE.

Opfinder: Guy Rasalia Eugene Van *Lommen; BE, Marcel Frans Leopold De *Bruyn; BE, Marc Francis Josephine *Schroven; BE.

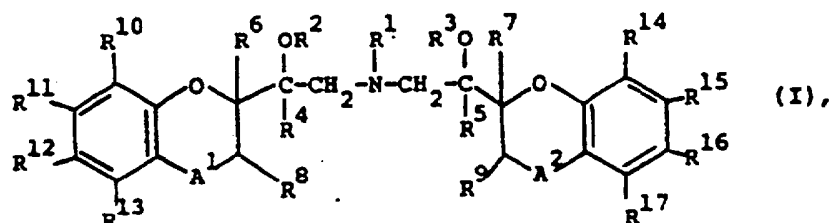
Fuldmægtig: Th. Ostfeld Patentbureau A/S

2,2'-iminobisethanol-derivater og fremgangsmåde til fremstilling deraf

SAMMENDRAG

5770-84

2,2'-iminobisethanolderivater med formelen



hvor R^1 er hydrogen, C_{1-6} alkyl, aryl, aryl- C_{1-6} alkyl, C_{1-12} alkylcarbonyl eller arylcarbonyl,

R^2 og R^3 uafhængigt af hinanden er hydrogen, C_{1-12} alkylcarbonyl eller arylcarbonyl,

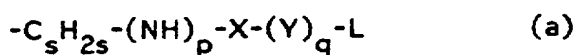
R^4 , R^5 , R^6 og R^7 uafhængigt af hinanden er hydrogen eller C_{1-6} alkyl,

A^1 og A^2 uafhængigt af hinanden er en direkte binding, $-CH_2->C=O$ eller et funktionelt derivat deraf, $>C=S$, $>CH-OH$ eller $>CH-O-CO(C_{1-12}alkyl)$,

R^8 og R^9 er hydrogen, eller gruppen $-A^1-CHR^8-$ og/eller gruppen $-A^2-CHR^9-$ hver for sig kan betegne en 1,2-ethendiylgruppe,

og

R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} og R^{17} uafhængigt af hinanden er hydrogen, halogen, C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, C_{1-6} alkyloxy, C_{2-6} alkenylmethoxy, C_{1-6} alkylthio, trifluormethyl, hydroxy, amino, mono- eller $di(C_{1-6}$ alkyl)amino, arylamino, (aryl- C_{1-6} alkyl)amino, cyano, nitro, aryl, aryloxy, aryl C_{1-6} alkyloxy, C_{1-6} alkyloxy C_{1-6} alkyl eller en gruppe med formlen



hvor s er 0 eller et heltal fra 1 til 6,

p og q uafhængigt af hinanden er 0 eller heltallet 1,

X er $>C=O$, $>C=S$ eller $-S(=O)_2-$,

Y er NH eller O , og

L er hydrogen, C_{1-6} alkyl, aryl eller aryl- C_{1-6} alkyl, eller to vicinale grupper blandt R^{10} , R^{11} , R^{12} og R^{13} og blandt R^{14} , R^{15} , R^{16} og R^{17} kan fuldende en aromatisk-, alicyklisk-, dioxanyl- eller dioxolanylring,

under forudsætning af, at ikke mere end to grupper blandt R^{10} , R^{11} , R^{12} og R^{13} eller blandt R^{14} , R^{15} , R^{16} og R^{17} er amino, mono- eller $di(C_{1-6}$ alkyl)amino, arylamino, (aryl- C_{1-6} alkyl)amino, nitro, aryl, aryloxy eller en gruppe med formel (a),

hvor aryl som anvendt i de ovennævnte definitioner er phenyl, som eventuelt er substitueret med op til tre substituenten, der uafhængigt af hinanden er udvalgt fra gruppen bestående af halogen, lavere alkyl, lavere alkyloxy, lavere alkylthio, trifluormethyl, nitro og amino, og

hvor de funktionelle derivater af $>C=O$ er oximer, hydrazoner, $di(lavere\ alkyl)ketal$ er, en dioxolan- eller dioxanring og de tilsvarende dithioketal, samt farmaceutisk acceptable syreadditionssalte eller stereokemisk isomere former deraf,

besidder nyttige egenskaber til behandling og/eller forebyggelse af forstyrrelser i det koronare, vaskuløse system.