

C 07 D 219

Ans.nr.: 4655/83

Indleveret: 10 okt 1983

Løbedag: 10 okt 1983

Alm. tilgængelig: 12 apr 1984

Prioritet: 11 okt 1982 DE 3237649

24 dec 1982 DE 3247908

*HOECHST AKTIENGESSELLSCHAFT; Frankfurt/Main, DE.

Opfinder: Erhardt *Winkelmann; DE, Walter

*Duerckheimer; DE, Wolfgang *Raether; DE.

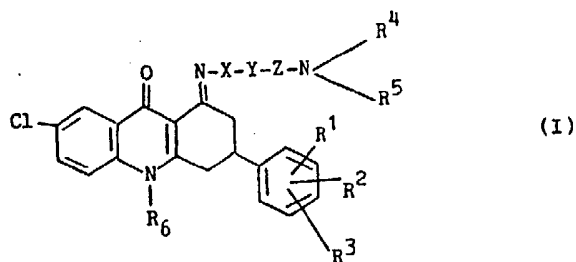
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

3-Aryl-7-chlor-3,4-dihydro-acridin-1,9-(2H,10H)-dion-1-oximer og
-1-hydrazonderivater, salte deraf, fremgangsmåde til fremstilling deraf, midler indeholdende disse forbindelser samt deres anvendelse

SAMMENDRAG.

4655-83

3-Aryl-7-chlor-3,4-dihydro-acridin-1,9-(2H,10H)-dion-1-oximer og -1-hydrazonderivater med formlen



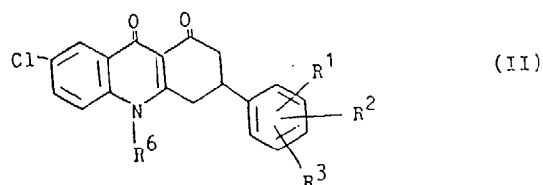
hvor R^1 , R^2 og R^3 er ens eller forskellige og betyder hydrogen, halogen, C_1 - C_4 -alkyl, trifluormethyl, C_1 - C_4 -alkoxy, trifluormethoxy, difluorchlormethoxy, 1,1,2,2-tetrafluorethoxy, phenoxy, halogenphenoxy, C_1 - C_4 -alkyl-, phenyl- og naphthyl-thio, C_1 - C_4 -alkyl-, phenyl- og naphthyl-sulfinyl, C_1 - C_4 -alkyl-, phenyl- og naphthyl-sulfonyl, trifluorme-

thylthio, carbamyl, sulfamyl, cyano eller nitro,

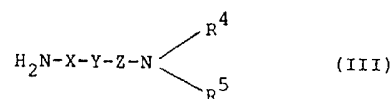
- a) X betyder oxygen, Y betyder en enkeltbinding, og Z betyder en ligekædet eller forgrenet alkylenkæde med 2-5 carbonatomer, som eventuelt er substitueret med en hydroxygruppe, eller
 - b) X, Y og Z betyder en enkeltbinding, eller
 - c) X betyder en -NR-gruppe, hvori R betyder hydrogen eller C₁-C₄-alkyl, Y betyder en enkeltbinding, og Z betyder en ligekædet eller forgrenet alkylenkæde med 2-5 carbonatomer, eller
 - d) X betyder en -NR-gruppe, hvori R betyder hydrogen eller C₁-C₄-alkyl, Y betyder en carbonyl-, thiocarbonyl- eller iminocarbonyl-gruppe, og Z betyder en enkeltbinding, eller
 - e) X betyder en -NR-gruppe, hvori R betyder hydrogen eller C₁-C₄-alkyl, Y betyder en carbamid-, thiocarbamid- eller carbamidin-gruppe, og Z betyder en ligekædet eller forgrenet alkylenkæde med 2-5 carbonatomer, eller
 - f) X betyder en -NR-gruppe, hvori R betyder hydrogen eller C₁-C₄-alkyl, Y betyder en carbonylgruppe, og Z betyder en ligekædet eller forgrenet alkylenkæde med 1-3 carbonatomer, eller
 - g) X betyder en -NR-gruppe, hvori R betyder hydrogen eller C₁-C₄-alkyl, Y betyder en carboxygruppe, og Z betyder en ligekædet eller forgrenet alkylenkæde med 2-5 carbonatomer, og
- R⁴ og R⁵ er ens eller forskellige og betyder hydrogen eller ligekædet eller forgrenet C₁-C₄-alkyl, eller R⁴ og R⁵ tilsammen er en alkylenkæde med 4-6 carbonatomer, som med nitrogenatomet danner en 5-7 leddet heterocyclisk ring, hvori en -CH₂-gruppe kan være erstattet med et yderligere heteroatom valgt blandt nitrogen, oxygen og svovl, og hvorhos den heterocycliske ring selv kan være substitueret med en eventuelt med en hydroxygruppe substitueret alkylgruppe med 1-3 carbonatomer eller med phenyl- eller naphthyl, C₁-C₃-

4655-83

-alkyl eller phenyl eller naphthyl, eventuelt substitueret med methyl, methoxy, chlor eller trifluormethyl, og R^6 betyder hydrogen eller en hydroxylgruppe, samt fysiologisk acceptable syreadditions- og ammoniumsalte deraf, kan fremstilles ved omsætning af 3-aryl-7-chlor-3,4-dihydro-acridin-1,9-(2H,10H)-dion med formlen



med en forbindelse med formlen



eller med salte deraf, hvorpå reaktionsproduktet eventuelt omdannes til et additionssalt med en fysiologisk acceptabel syre eller omdannes til ammoniumsalt med et alkyleringsmiddel.

Forbindelserne (I) er anvendelige som kemoterapeutika og virker mod protozoer, især malaria-plasmodier.