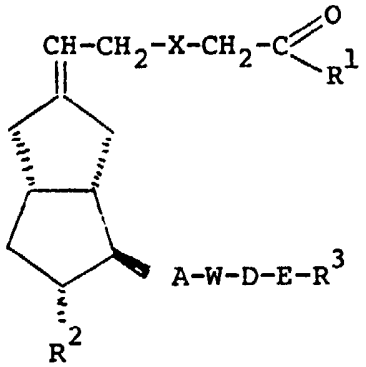
C 07 C 103/737 Ans.nr.: 3035/83
Indleveret: 01 jul 1983
Løbedag: 01 jul 1983
Alm. tilgængelig: 03 jan 1984
Prioritet: 02 jul 1982 DE 3225287
*SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT; Berlin und Bergkamen, DE.
Opfinder: Werner *Skuballa; DE, Bernd *Raduechel; DE, Helmut *Vorbrueggen; DE, Gerda *Mannesmann; DE, Bob *Bieuweboer; DE, Michael Harold *Town; DE.
Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

Carbacyklinamider samt fremgangsmåde til fremstilling heraf

SAMMENDRAG.

3035-83

Carbacyklinamider med formlen I



(I),

hvori

R^1 betegner gruppen $-NHR^4$ med R^4 som H, $-(CH_2)_n-R^8$ eller ligekædet eller forgrenet alkylgruppe med 1 - 10 carbonatomer, cykloalkylgruppe med 3 - 10 carbonatomer, aryl eller lavere mono- eller polyhydroxyalkylgruppe med 2 - 8 carbonatomer, NR^5R^6 med R^5 og R^6 hver som ligekædet eller forgrenet lavere mono- eller polyhydroxyalkylgruppe med 2 - 8 carbonatomer eller R^5 og R^6 sammen med N som 5- eller 6-leddet heterocyklisk ring, som kan indeholde yderligere heteroatomer og kan være substitueret eller NR^5R^6 som alkylgruppe med 1 - 10 carbonatomer, cykloalkylgruppe med 3 - 10 carbonatomer og R^6 som ligekædet eller forgrenet alkylgruppe med 1 - 10 carbonatomer, cykloalkylgruppe med 3 - 10 carbonatomer, aryl eller lavere mono- eller polyhydroxyalkylgruppe med 2 - 8 carbonatomer,

R^8 betegner gruppen $-CONH_2$ eller $-N(C_1-C_4\text{-alkyl})_2$,

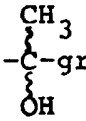
R^2 betegner en fri eller funktionelt afledt hydroxygruppe,

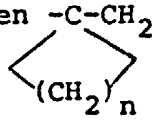
R^3 betegner en alkyl-, cykloalkyl- eller en eventuelt substitueret arylgruppe eller en heterocyklisk gruppe,

X betegner et oxygenatom eller gruppen $-CH_2-$,

A betegner en $-CH_2-CH_2-$, trans-CH=CH- eller $-C\equiv C-$gruppe,

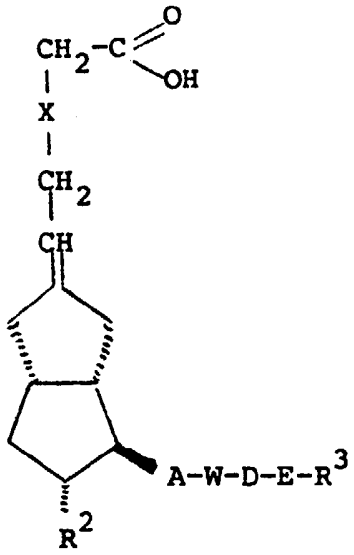
W betegner en fri eller funktionelt aflydt hydroxymethylengruppe eller en fri eller funktionelt afledt


-gruppe, hvor OH-gruppen kan være α- eller β-stillet,

D betegner gruppen , en ligekædet eller forgrenet

alkylengruppe med 1 - 5 carbonatomer, en forgrenet mættet eller en ligekædet eller forgrenet umættet alkylengruppe med 2 - 5 carbonatomer, der eventuelt kan være substitueret med fluoratomer,

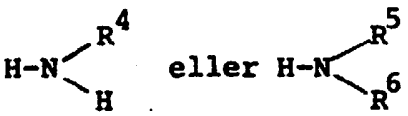
E betegner en direkte binding, en -C≡C-gruppe eller en $-CR^7=CR^8-$gruppe, hvor R^7 og R^8 betegner et hydrogenatom eller en alkylgruppe med 1 - 5 carbonatomer, kan fremstilles ved, at man omsætter en forbindelse med formlen II



(II),

hvori

R^2, R^3, X, A, W, D og E har de ovenfor anførte betydninger, eventuelt efter beskyttelse af tilstedeværende frie hydroxygrupper, med aminer med formlen III



(III),

hvori

R^5 og R^6 har ovennævnte betydning, efter forudgående om-

sætning med chlormyresyreisobutylester i nærværelse af en tertiær amin og eventuelt derpå frigør beskyttede hydroxygrupper og forestrer eller forethrer frie hydroxygrupper og adskiller i de isomere.

Forbindelserne med formlen I virker bronchodilatorisk og egner sig til inhibering af thrombocytaggregation, til blodtrykssænkning via en vasodilation og til hæmning af mavesyresekretionen.