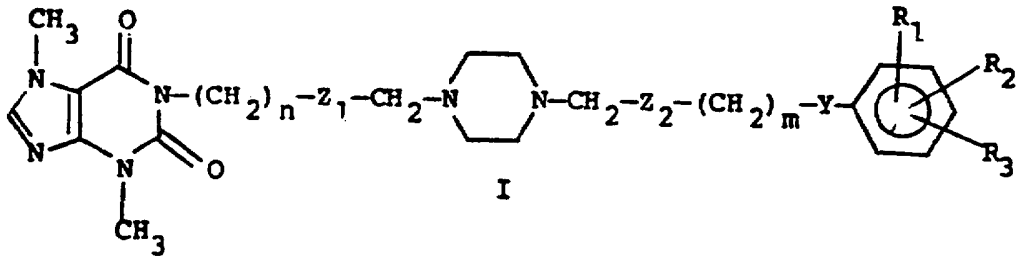
C 07 D 473 Ans.nr.: 3428/82
Indleveret: 30 jul 1982
Løbedag: 30 jul 1982
Alm. tilgængelig: 01 feb 1983
Prioritet: 31 jul 1981 US 288847
*LAROCHE–NAVARRON S.A.; Puteaux, FR.
Opfinder: Colette *Favier; FR, Henri *Pinhas; FR, Serge *Beranger; FR, Jean–Claude *Pascal; FR.
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbureau

Theobrominderivater

SAMMENDRAG

3428-82

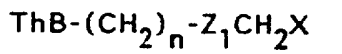
Forbindelser med den almene formel I



I

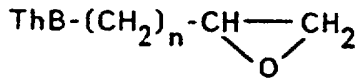
hvor Z_1 og Z_2 hver især uafhængigt af hinanden udvælges blandt gruppen bestående af CH_2, CHOB og C=O, hvor B udvælges blandt gruppen bestående af hydrogen og alkanoyl, Y betegner oxygen eller svovl, n er et helt tal mellem 0 og 4, men kan ikke være 0, når Z_1 betegner CHOB, m er et helt tal mellem 0 og 4, men kan ikke være 0, når Z_2 betegner CHOB, og R_1, R_2 og R_3 hver især betegner hydrogen, halogen, hydroxy, trifluormethyl, alkyl eller alkoxy eller farmaceutisk tolerable syreadditionssalte deraf, fremstilles ved, at

a) en forbindelse med den almene formel IIa



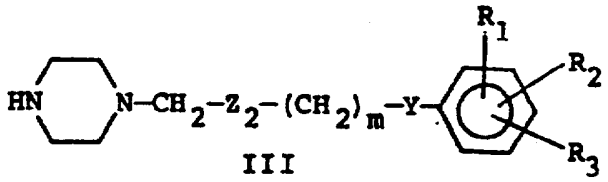
IIa

eller



IIb

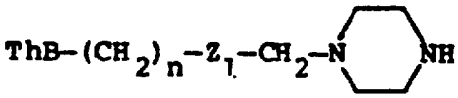
hvor Z_1 og n har den ovenfor anførte betydning, reageres med en forbindelse med den almene formel III



III

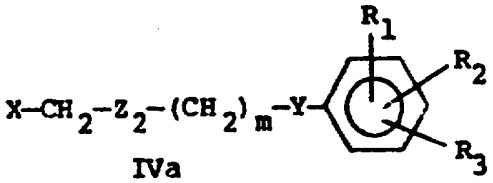
hvor Z_2, m og Y har den ovenfor anførte betydning, eller

b) en forbindelse med den almene formel V



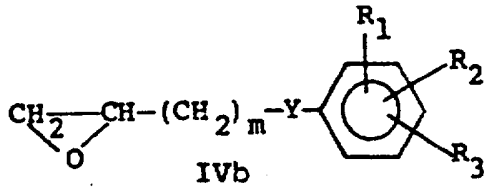
V

hvor Z_1 og n har den ovenfor anførte betydning, reageres med en forbindelse med den almene formel IVa



IVa

eller



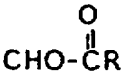
IVb

hvor Z_2, m og Y har den ovenfor anførte betydning, eller

c) en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner CHOH, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, oxideres til en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner C=O, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, eller

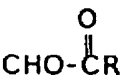
d) en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner C=O, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, reduceres til en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner CHOH, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, eller

e) en forbindelse med formlen I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner CHOH, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, esterificeres til en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner



og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, eller

f) en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner



og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, hydrolyseres til en forbindelse med den almene formel I, hvor Z_1 og/eller Z_2 betegner CHOH, og Y, n, m, R_1, R_2 og R_3 har den ovenfor anførte betydning, eller

g) den frie base af forbindelsen med den almene formel I omdannes til et farmaceutisk tolerabelt syreadditionssalt, eller

h) et salt af en forbindelse med den almene formel I omdannes til en fri base, eller

i) et salt af en forbindelse med den almene formel I omdannes til et andet salt.

Disse forbindelser er antihistaminer og kan derfor anvendes i behandlingen af åndedrætssygdomme, herunder astma, høfeber, allergier og forkølelse. Forbindelserne er også vasodilatoriske midler og kan anvendes til forebyggelse og/eller behandling af myocardieinfarkt.