

C 07 D 239

Ans.nr.: 1970/85

Indleveret: 02 maj 1985

Løbedag: 02 maj 1985

Alm. tilgængelig: 03 nov 1985

Prioritet: 02 maj 1984 GB 8411291

*NYEGAARD & CO. A/S; Oslo, NO.

Opfinder: Kjell *Undheim; NO, Toro *Benneche;
US.

Fuldmægtig: Kontor for Industriel Eneret

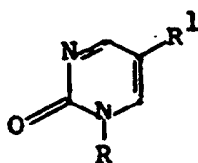
Pyrimidinonderivater og farmaceutiske præpa-
rater indeholdende sådanne forbindelser

Sammendrag

1970-85

Pyrimidinonderivater og farmaceutiske præparater inde-
holdende sådanne forbindelser

Bisulfitaddukter af forbindelser med formel I

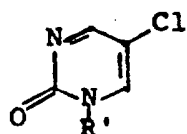


I

hvor R er en gruppe $R^2-\text{CH}-X-(\text{CR}^4\text{R}^5)_n\text{R}^3$; R^1 halogen eller trifluormetyl; R^2 hydrogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkanoyl eller fenyl; X oxygen, svovl eller $>\text{NR}^6$ (hvor R^6 er formyl, C_{1-4} alkanoyl eller C_{1-4} alkoxykarbonyl); R^3 en C_{6-10} karboxyklisk aromatisk eller en heterocyklisk gruppe med en 5- eller 6-leddet umættet heterocyklisk ring indeholdende et eller flere af heteroatomerne O, N og S og eventuelt med en tilkondenseret karbocyklisk ring, idet den karbocykliske eller heterocykliske gruppe kan indeholde

substituenten udvalgt blandt halogener, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkanoyl, C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} alkoxykarbonyl, C_{1-4} alkyltio, hydroxy, nitro, cyan, formyl, $-NR^7R^8$ (hvor R^7 er hydrogen eller C_{1-4} alkyl og R^8 hydrogen eller C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkanoyl eller aroyl) eller C_{1-4} alkyl substitueret med en eller flere hydroxy- eller $-NR^7R^8$ grupper og halogenatomer; n tallet 0 eller 1; og R^4 og R^5 uafhængigt af hinanden er hydrogen eller C_{1-6} alkyl, eller salte af disse addukter har metafasestandsende egenskaber og god vandopløselighed og kan være nyttige ved bekæmpelse af abnorm celleformering.

Forbindelserne kan fremstilles ved omsætning af pyrimidinonderivater med et stof der afgiver bisulfationer, eventuelt i nærværelse af en faseoverføringskatalysator. Nyttige mellemprodukter til fremstilling af forbindelser med formel I er forbindelser med formel III



III

hvor R' er en gruppe $-CH_2OR^{3'}$ (hvor $R^{3'}$ er 4-formylsubstitueret fenyl) eller $CH_2OCH_2R^{3'}$ (hvor $R^{3'}$ er 3- eller 4-metylsubstitueret fenyl eller 3- og 4-klorsubstitueret fenyl) eller salte deraf.