

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING⁽¹⁰⁾ DK 2847/89 A

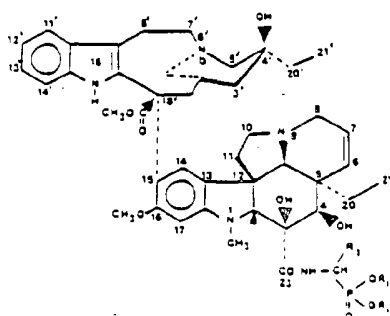
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 2847/89
(22) Indleveringsdag:.... 09 jun 1989
(24) Løbedag:..... 09 jun 1989
(41) Alm. tilgængelig:.... 11 dec 1989
(62) Stamansøgningsnummer:.....
(86) International ansøgning nr.:... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 10 jun 1988 FR 8807742
(71) Ansøger: *Adir Et Compagnie, 22 Rue Garnier; F-92201 Neuilly Sur Seine, FR
(72) Opfinder: Gilbert *Lavielle, 1 Avenue Lilly; F-78170 La Celle Sint-Cloud, FR
Patrick *Hautefaye, 9 Rue du Pre aux Moutons; F-77170 Servon Brie Comte Robert, FR
(74) Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude, H.C. Andersens Boulevard 33, 1553, København V
- (51) Int. Cl. 5: C 07 F 9/6561

- (54) Fremgangsmåde til fremstilling af N-(23-vinblastinoyl)-derivater af 1-aminomethylphosphonsyre
(57) Sammendrag

2847-89

Fremgangsmåde til fremstilling af derivater med formlen I



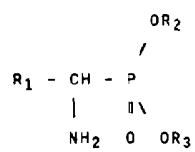
hvor

R₁ betegner et hydrogenatom, en alkylgruppe, en alkylengruppe, en arylalkylgruppe, der som substituent på den aromatiske ring kan have et halogenatom, en hydroxylgruppe eller en alkyl- eller alkoxygruppe, en 2-indolylmethylgruppe, en 4-imidazolymethylgruppe eller en alkoxy-carbonylmethylgruppe, og R₂ og R₃, der kan være ens eller forskellige, hver betegner en alkylgruppe,

ved hvilken vinblastinsyre kondenseres med N,N'-carbonyldiimidazol ved stuetemperatur og i et vandfrit polært opløsningsmiddel under en inert atmosfære, og et aminophosphonat med formlen

fortsættes

2847-89



i hvilken R_1 , R_2 og R_3 har den samme betydning som den i formelen I angivne, derpå tilføres til reaktion i reaktionsmediet, og mediet derefter hydrolyseres med vand, og de forventede forbindelser med den almene formel I ekstraheres ved hjælp af en chloreret hydrocarbon.