

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING (10) DK 0707/90 A

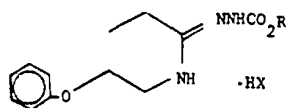
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 0707/90 (51) Int.Cl. 5: C 07 C 281/02
(22) Indleveringsdag:.... 19 mar 1990
(24) Løbedag:..... 29 nov 1984
(41) Alm. tilgængelig:.... 19 mar 1990
(62) Stamansøgningsnummer:..... 5673/84
(86) International ansøgning nr.:... -
(86) International indleveringsdag:
(85) Videreførselsdag:
(30) Prioritet: 30 nov 1983 US 556727
(71) Ansøger: *Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue; New York; N.Y.
10154, US
(72) Opfinder: Gary D. *Madding, 710 South Weinbach Avenue; Evansville;
Indiana 47714, US
(74) Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S, Rømersgade 3; Box 1183, 1011,
København K

- (54) Alkyl- (1 ((2-phenoxyethyl) amin) propyliden) hydrazincarboxylater eller
syreadditionssalte deraf og fremgangsmåde til deres fremstilling
(57) Sammendrag

707-90

Alkyl-[1-[(2-phenoxyethyl)amin]propyliden]hydrazincarboxylater
eller syreadditionssalte deraf med formel (II)



(II)

hvor

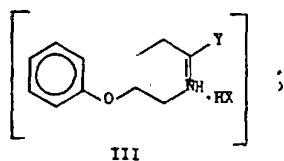
R er lavere (C₁-C₄)alkyl, og

X er en anion,

og deres fremstilling ved a) omsætning af phenol med 2-ethyl-2-oxazolin
(V) til dannelse af N-(2-phenoxyethyl)propionamid (IV), b) aktivering af
amidfunktionsgruppen i forbindelse (IV) ved omsætning af forbindelse
(IV) med et amidaktiverende middel, således at der dannes et
imidoylhalogenid eller -estermellemprodukt med formel (III)

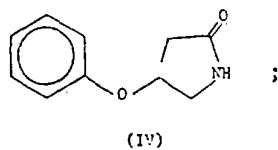
fortsættes

707-90



hvor y fortrinsvis er et halogen eller en alkoxygruppe, og X er en anion, der stammer fra omsætningen mellem det amidaktiverende middel og forbindelsen (IV), og c) omsætning af produktet ifølge trin b) uden isolering af forbindelsen (III) med en carbazatester med formelen H_2NNHCO_2R til dannelsen af en forbindelse med formel (II).

Forbindelserne med formel (I) kan benyttes som mellemprodukt ved fremstilling af forbindelsen (I)



der er et værdifuldt mellemprodukt ved fremstilling af det antidepressive middel, nefazodon.