

C 07 D 471

Ans.nr.: 5426/84

Indleveret: 15 nov 1984

Løbedag: 15 nov 1984

Alm. tilgængelig: 19 maj 1985

Prioritet: 18 nov 1983 US 553157

18 nov 1983 US 553158

*RIKER LABORATORIES INC.; Saint Paul, US.

Opfinder: John F. *Gerster; US.

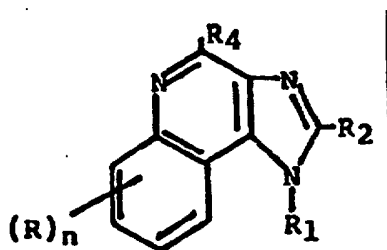
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

1H-Imidazo(4,5-c)quinolin eller derivat deraf, fremgangsmåde til fremstilling deraf og farmaceutisk præparat indeholdende en sådan forbindelse

SAMMENDRAG

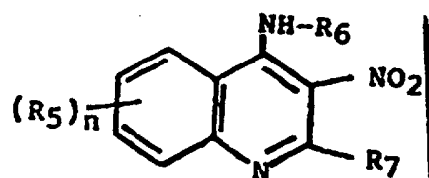
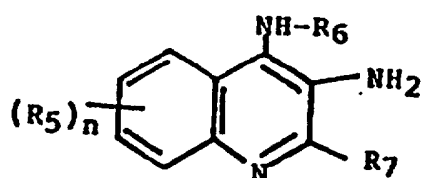
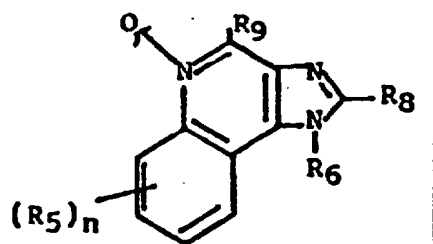
5426-84

Substituerede 1H-imidazo[4,5-c]quinoliner og 1H-imidazo-[4,5-c]quinolin-4-aminer med formlen



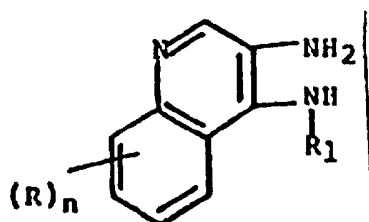
og farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf er nyttige bronchodilatatoriske og antivirale midler samt mellemprodukter. I forbindelsen med formlen I betegner R₁ hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl, eventuelt substitueret benzyl, eventuelt substitueret (phenyl)ethyl, eventuelt substitueret phenyl; R₂ betegner hydrogen, trifluormethyl, hydroxyalkyl, aminoalkyl, alkanamidoalkyl, benzylthio, mercapto, alkylthio eller alkyl; R₄

er amino, chlor, hydrogen, alkoxy, hydroxy, alkylamino, dialkylamino, alkyl, phenylthio, alkylthio eller morpholino, R er alkoxy, alkyl eller halogen, og n er et helt tal 0 - 2. Forbindelserne

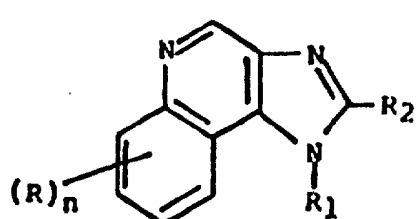


er nyttige mellemprodukter. I disse forbindelser betegner R_6 alkyl, hydroxyalkyl, acyloxyalkyl, eventuelt substitueret benzyl, eventuelt substitueret (phenyl)ethyl og eventuelt substitueret phenyl; R_8 er hydrogen, tri-fluormethyl, hydroxyalkyl, aminoalkyl, alkyl eller alkanamidoalkyl; R_9 er hydrogen eller methyl; og hver gruppe R_5 kan være halogen, alkoxy eller alkyl, og n er et helt tal 0 - 2. Der beskrives endvidere en fremgangsmåde til fremstilling af en 1H-imidazo[4,5-c]quinolin-4-amin med formelen I, hvori R_4 er NH_2 ved kondensation og ringslutning af en 3-aminoquinolin med formelen

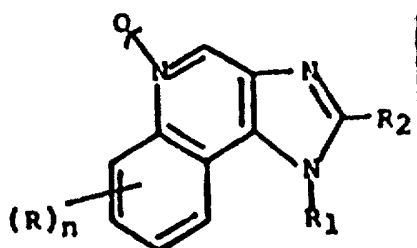
5426-84



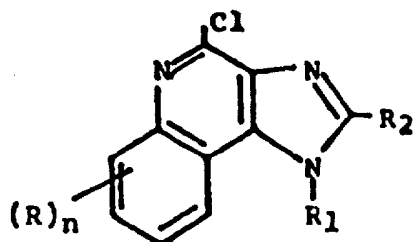
til opnåelse af et mellemprodukt med formlen



hvilket mellemprodukt oxideres til et andet mellemprodukt



som chloreres til et mellemprodukt med formlen



som amineres til tilvejebringelse af den ønskede 1H-imidazo[4,5-c]quinolin-4-amin, der eventuelt overføres i et farmaceutisk acceptabelt syreadditionssalt deraf. Der omhandles farmaceutiske præparater indeholdende de bronchodilatatoriske og antivirale midler.

