

C 07 D 319

Ans.nr.: 5899/85

Indleveret: 18 dec 1985

Løbedag: 18 dec 1985

Alm. tilgængelig: 22 jun 1986

Prioritet: 21 dec 1984 NL 8403918

*DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B.
V.; Weesp, NL.

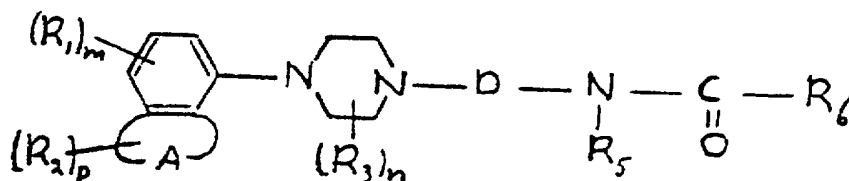
Opfinder: J. *Hartog; NL, W. *Wouters; NL, I.
Van *Wijngaarden; NL.

Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau
Bicycliske heteroarylpiperazinderivater og
fremgangsmåde til deres fremstilling

SAMMENDRAG

5899-85

En gruppe hidtil ukendte bicycliske heteroarylpiperazin-
derivater med formlen



hvor

- A sammen med de to carbonatomer i phenylgruppen danner en helt eller delvis umættet cyclisk gruppe med 5-7 ringatomer, af hvilke 1-3 er heteroatomer fra gruppen omfattende O, S og N, forudsat at summen af antallet af oxygenatomer og svovlatomer højst er 2, og at nitrogenatomerne i ringen kan være substitueret med en gruppe R_4 , som kan være hydrogen, alkyl, hydroxyalkyl eller acyl;

R₁ og R₂ kan betegne alkyl, cycloalkyl, eventuelt substitueret phenyl eller heteroaryl, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, alkoxy, aryloxy, alkylthio, arylthio, mono- eller dialkylamino, mono- eller diarylamino, hydroxyl, amino, alkyl-, alkoxy-, amino- eller monoalkylamino- eller dialkylaminocarbonyl, nitro, cyano, halogen, trifluormethyl, trifluormethoxy, alkyl- eller amino- eller mono- eller dialkylaminosulfonyl; R₂ endvidere kan betegne en oxogruppe eller thioxogruppe; m er 0-3, og p er 0-2;

R₃ betegner en alkylgruppe, og n er 0-2;

D betegner en eventuelt forgrenet alkylenkæde,

R₅ betegner hydrogen, og

R₆ betegner alkyl, cycloalkyl, en phenylgruppe, som eventuelt er substitueret med en gruppe R₁, hvori R₁ har den ovenfor angivne betydning, eller R₆ betegner en mættet eller umættet heterocyclisk gruppe,

og syreadditionssalte og prodrugs deraf kan anvendes som udgangsmaterialer til fremstilling af andre forbindelser. Endvidere har nogle af forbindelserne en interessant blodtryks-sænkende aktivitet.