

C 07 D 471

Ans.nr.: 2169/83

Indleveret: 16 maj 1983

Løbedag: 16 maj 1983

Alm. tilgængelig: 18 nov 1983

Prioritet: 17 maj 1982 US 378945

*PFIZER INC.; New York, US.

Opfinder: Berkeley Wendell *Cue Jr.; US.

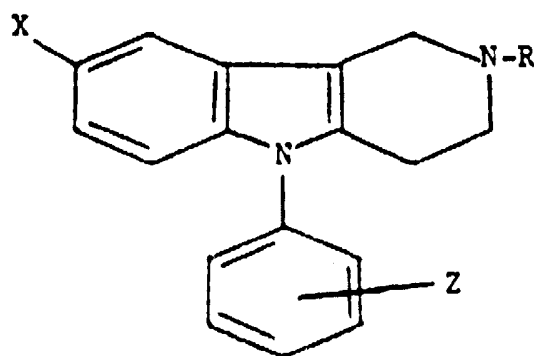
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af 2-substituerede 5-aryl-1,2,3,4-tetrahydro- γ -carbolin-derivater og forbindelser der er nyttige som mellemprodukter derved

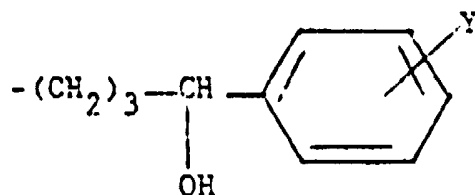
SAMMENDRAG:

2169-83

Fremstilling af 2-substituerede 5-aryl-1,2,3,4-tetrahydro- γ -carbolin-derivater med formlen



hvor X er H, F, Cl eller Br, Z er H, F, Cl eller OCH_3 , og R er gruppen



hvor Y er H, CH₃, F eller Cl, ved (1) kvaternisering af en tilsvarende 5-aryl- γ -carbolin-forbindelse med et passende aralkylhalogenid i nærvær af natriumiodid, efterfulgt af (2) reduktion af det dannede kvaternære carboliniumiodid-salt med et alkalimetallhydrid.

De fremstillede forbindelser er kendt for at være nyttige som beroligelsesmidler med 2-[4-(p-fluorphenyl)-4-hydroxybutyl]-5-(p-fluorphenyl)-8-fluor-1,2,3,4-tetrahydro- γ -carbolin (flutrolin) som det foretrukne produkt, og disse forbindelser opnås særlig let i højt udbytte og med lave produktionsomkostninger ved denne fremgangsmåde.

5'-aryl- γ -carbolin-udgangsmaterialerne og de som mellemprodukter dannede carboliniumiodid-salte er alle hidtil ukendte forbindelser.