

C 07 D 513

Ans.nr.: 5734/85

Indleveret: 11 dec 1985

Løbedag: 11 dec 1985

Alm. tilgængelig: 13 jun 1986

Prioritet: 12 dec 1984 FR 8418990

*RHONE-POULENC SANTE; Courbevoie, FR.

Opfinder: Jean-Louis *Fabre; FR, Daniel *Far-
ge; FR, Claude *James; FR.

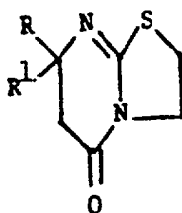
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou &
Co

Fremgangsmåde til fremstilling af optiske iso-
mere af thiazolo-(3,2-a)pyrimidiner, de
fremstillede isomere, farmaceutiske præparater
indeholdende disse og mellemprodukter til
gennemførelse af fremgangsmåden

SAMMENDRAG.

5734-85

Optiske isomere af thiazolo[3,2-a]pyrimidiner med den
almene formel I

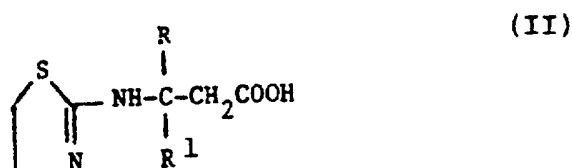


(I)

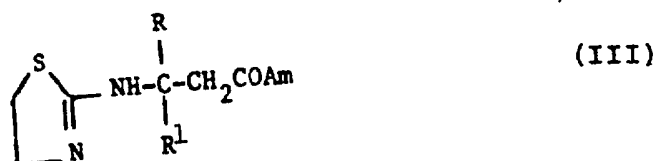
hvor R betyder en phenyl- eller benzylgruppe, der
eventuelt er substitueret med et eller flere halogen-
atomer eller alkyl-, alkoxy- eller alkylthiogrupper, eller
R betyder en alkylgruppe (usubstitueret eller substitueret
med 1-3 halogenatomer), en alkenylgruppe eller en cyclo-
alkylgruppe, og R¹ betyder et hydrogenatom, eller R og
R¹, der er forskellige, betyder en phenyl- eller benzyl-
gruppe, der eventuelt er substitueret med et eller flere
halogenatomer eller alkyl-, alkoxy- eller alkylthiogrupper,

eller betyder en alkylgruppe, samt salte deraf med farmaceutisk acceptable syrer, der er anvendelige til behandling af reumatiske sygdomme, fremstilles ved

a) ringåbning af en forbindelse med den almene formel I i racemisk form til dannelse af en racemisk intermediær syre (i ligevægt med sin iminform) med den almene formel II



b) omsætning af forbindelsen med den almene formel II i racemisk form med en optisk aktiv organisk base til dannelse af en forbindelse med den almene formel III



hvor Am betyder en optisk aktiv aminogruppe, og som foreligger i form af en blanding af de to diastereoisomere former,

c) separation af blandingen af de to diastereoisomere former af forbindelsen med den almene formel III, og d) særskilt hydrolyse og ringslutning af hver af de diastereoisomere former svarende til forbindelsen med den almene formel III til dannelse af den optisk aktive forbindelse med den almene formel I, hvorefter den dannede forbindelse isoleres og eventuelt omdannes til et salt med en farmaceutisk acceptabel syre.

Mellemprodukterne II, der er hidtil ukendte, har ligesom salte deraf farmakologiske egenskaber svarende til egenskaberne af forbindelserne I.