

C 07 D 487

Ans.nr.: 4013/85

Indleveret: 03 sep 1985

Løbedag: 03 sep 1985

Alm. tilgængelig: 05 mar 1986

Prioritet: 04 sep 1984 US 646888

17 jun 1985 US 744570

*BRISTOL-MYERS COMPANY; New York, US.

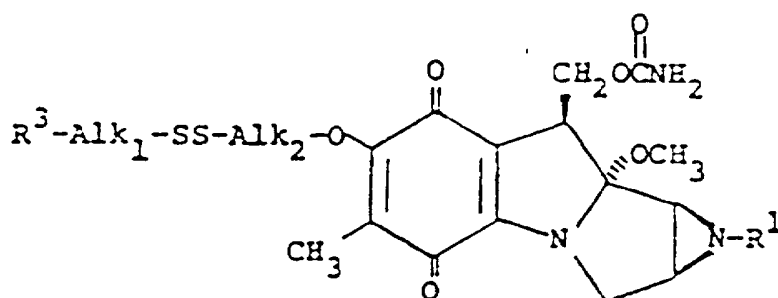
Opfinder: Dolatrai Mohanlal *Vyas; US, Terrence William *Doyle; US, Richard A. *Partyka; US.

Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S
7-Oxomitosan-derivater og fremgangsmåde til fremstilling deraf

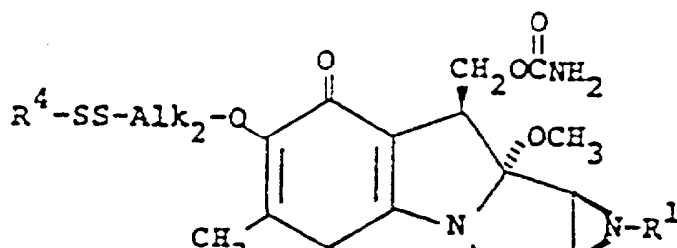
SAMMENDRAG

4013-85

7-oxomitosanderivater, der er udvalgt fra gruppen med formel (II) eller formel (III)



II



III

hvor

Alk_1 er en ligekædet eller forgrenet alkylengruppe med 1-6 carbonatomer, når R^3 er bundet dertil via et carbonatom, og 2-6 carbonatomer, når R^3 er bundet dertil via et svovl-, oxygen- eller nitrogenatom, og R^3 og $-\text{SS}-$ er i dette tilfælde bundet til forskellige carbonatomer,

Alk_2 er en ligekædet eller forgrenet alkylengruppe med 2-6 carbonatomer, der eventuelt bærer en A-substituent, hvori svovl- og oxygenatomerne, som er bundet dertil, og en eventuelt tilstedeværende A-substituent, som er bundet dertil via oxygen, svovl eller nitrogen, er bundet til forskellige carbonatomer af Alk_2 , hvor A-substituenten er udvalgt blandt én eller to af gruppen bestående af C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkanoyl, C_{1-6} alkoxy, halogen, C_{1-6} alkoxycarbonyl, cyano, C_{1-6} alkylamino, C_{1-6} dialkylamino, C_{1-6} alkanoylamino og C_{1-6} alkoxycarbonyl,

Alk_1 og Alk_2 kan indeholde en dobbeltbinding,

R^1 er hydrogen, lavere alkyl, lavere alkanoyl, benzoyl eller substitueret benzoyl, hvori substituenten er lavere alkyl, lavere alkoxy, halogen, amino eller nitro,

R^3 er udvalgt fra gruppen bestående af halogen, carboxy, alkanoyloxy med 1-7 carbonatomer, hydroxy, hvori oxygenatomer er bundet til Alk_1 med 3-6 carbonatomer, alkylamino eller dialkylamino med 1-12 carbonatomer, N-alkoxy-alkylamino med 2-7 carbonatomer, alkanoylamino med 1-7 carbonatomer, benzoylamino eller B-substitueret benzoylamino, naphthoylamino eller B-substitueret naphthoylamino, phenylamino eller B-substitueret phenylamino, cycloalkyl eller B-substitueret cycloalkyl, hver med 3-8 led i ringen, cycloalkenyl eller B-substitueret cycloalkenyl, hver med 5-8 led i ringen, phenyl eller B-substitueret phenyl, naphthyl eller B-substitueret naphthyl, en heterocyklisk gruppe udvalgt fra gruppen bestående af heteroaromatiske og heterocykliske grupper med fra 1 til 2 ringe, fra 3 til 8 led i hver ring og fra 1 til 2 heteroatomer i hver ring udvalgt blandt oxygen, nitrogen og svovl, pyridylamino eller thiazolylamino, alkoxy eller alkylthio, hver med 1-6 carbonatomer, alkoxycarbonyl eller alkylaminocarbonyl, hver med 2-7 carbonatomer, aminocarbonyl, phenoxycarbonyl eller B-substitueret phenoxycarbonyl, phenoxy eller B-substitueret phenoxy, naphthoxy eller B-substitueret naphthoxy,

alkoxycarbonylamino med 2-6 carbonatomer, ureido ($-\text{NHCONH}_2$), N-alkylureylen ($-\text{NHCONHalkyl}$) med 2-7 carbonatomer, N^3 -halogenalkylureylen med 3-7 carbonatomer, N^3 -halogenalkyl- N^3 -nitrosoureylen med 3-7 carbonatomer, dialkylaminocarbonyl med 3-13 carbonatomer, dialkylaminoalkoxy med 4-13 carbonatomer, alkanoylaminoalkoxy med 3-7 carbonatomer og hydroxyalkylamino eller N,N-dihydroxyalkylamino, hver med 2-8 carbonatomer, hvori B-substituenterne er udvalgt blandt én eller to af gruppen bestående af lavere alkyl, lavere alkanoyl, lavere alkoxy, halogen, amino, carboxy, hydroxy og nitro, og

R^4 er udvalgt fra gruppen bestående af alkyl med 1-12 carbonatomer, alkenyl eller alkynyl, hver med 3-12 carbonatomer, cycloalkyl eller B-substitueret cycloalkyl med 3-8 led i ringen, cycloalkenyl eller B-substitueret cycloalkenyl, hver med 5-8 led i ringen, phenyl eller B-substitueret phenyl, naphthyl eller B-substitueret naphthyl, en heterocyklisk gruppe udvalgt fra gruppen bestående af heteroaromatiske og heteroalicykliske grupper med fra 1 til 2 ringe, fra 3 til 8 led i hver ring og fra 1 til 2 heteroatomer i hver ring udvalgt blandt oxygen, nitrogen og svovl, under den forudsætning, at den heterocykliske gruppe er bundet via et carbonatom, som er bundet til mindst ét andet carbonatom (dvs., at det til $-\text{SS}-$ bundne carbonatom ikke selv må være bundet til to andre heteroatomer), hvor B-substituenten er udvalgt blandt én eller to af gruppen bestående af lavere alkyl, lavere alkanoyl, lavere alkoxy, halogen, amino, carboxy, hydroxy eller nitro, og R^4 og nabosvovlatomet tilsammen udgør S-cysteinyllgruppen, hvor S-cysteinyllgruppen kan være esterificeret, danne salt med eller være bundet i et ikke-toxisk og ikke allergi-fremkaldende peptid, eller et ikke-toxisk, farmaceutisk acceptabelt salt deraf, dremstilles. Derivaterne har farmakologisk virkning.