

C 07 D 223/00

Ans.nr.: 1608/85

Int. ans.nr.: PCT/EP84/00245

Int. indleveringsdag: 10 aug 1984

Videreførelsesdag: 10 apr 1985

Indleveret: 10 apr 1985

Løbedag: 10 aug 1984

Alm. tilgængelig: 10 apr 1985

Prioritet: 12 aug 1983 US 522948

*SCHERING CORPORATION; Kenilworth, US.

Opfinder: Joel Gilbert *Berger; US, Wei Kong

*Chang; US, Elijah Herman *Gold; US, Arthur

John *Elliott; US.

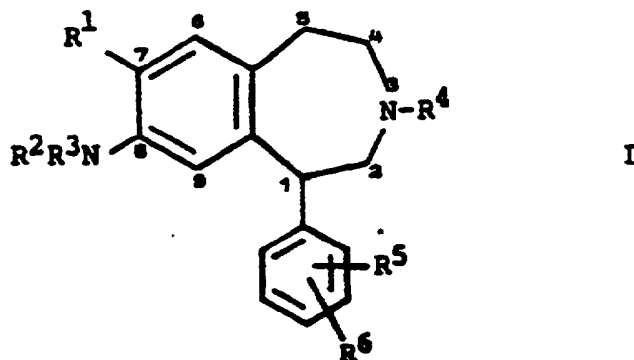
Fuldmægtig: Internationalt Patent-Bureau

Benzazepinderivater, fremgangsmåde til fremstilling deraf samt præparater indeholdende disse

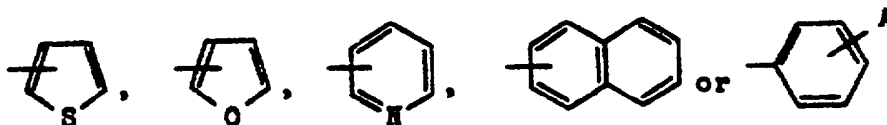
S A M M E N D R A G

1608-85

Benzazepinderivater med strukturformlen I

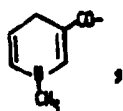


hvor R^1 er hydrogen, halogen, alkyl, $S(O)_n$ -alkyl, alkoxygruppe med fra 1-6 C-atomer, n er 0, 1 eller 2 eller trifluormethyl; R^2 er hydrogen, R^a [hvor R^a er alkyl med 1-6 C-atomer, $-(CH_2)_m$ -aryl (m er 0 eller et heltal fra 1 til 3, og aryl er



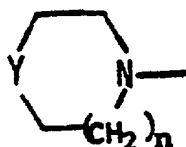
hvor A er hydrogen eller halogen, alkyl, $S(O)_n$.alkyl eller alkoxy med 1-6 C-atomer, n er 0, 1 eller 2, eller phenyl, hydroxy eller trifluormethyl)] eller $C(O)XR^a$ [hvor X er en binding, O, eller NR^b (hvor R^b er hydrogen eller alkyl med 1-6 C-atomer), og XR^a kan være NH_2],

SO_2R^a eller $CONHSO_2R^a$, R^3 er hydrogen eller formyl, eller såfremt R^2 er alkyl med 1-6 C-atomer, kan R^3 også være alkyl med 1-6 C-atomer eller R^a , eller R^2 og R^3 sammen med det nitrogen, hvortil de er bundet, danner en gruppe



hvor Y er O, CH_3 eller NR^b , og n er 0, 1 eller 2, forudsat at n ikke er 0, såfremt Y er O eller NR^b ; R^4 er hydrogen eller alkyl med 1-6 C-atomer, hver af R^5 og R^6 , der kan være ens eller forskellige, er hydrogen, halogen, alkyl, $S(O)_n$.alkyl med 1-6 C-atomer, trifluormethyl, OR^b , eller R^5 og R^6 sammen danner $-OCH_2O-$, der substituerer nabostillinger i den kondenserede benzenring; samt farmaceutisk acceptable salte deraf.

Forbindelserne fremstilles ved som hovedtrin, at et amid med formlen $HO.C(CH_3)_2.CO.NH-$ B hydrolyseres til en 8-aminobenzazepin med formlen H_2N- B, hvor B er en benzazepin-8-ylgruppe med formlen



1608-85

hvorefter den resulterende 8-aminobenzazepin med formlen H_2N- B om ønsket eller efter behov kan underkastes et eller flere af en række sluttrin i en vilkårlig ønsket rækkefølge.

Forbindelserne og deres salte er anvendelige ved behandlingen af mentale lidelser, såsom schizofreni og depression.

