

C 07 D 513

Ans.nr.: 1132/83

Indleveret: 08 mar 1983

Løbedag: 08 mar 1983

Alm. tilgængelig: 10 sep 1983

Prioritet: 09 mar 1982 DE 3208437

*BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; Leverkusen, DE.

Opfinder: Axel *Ingendoh; DE, Horst *Meyer; DE, Bernward *Garthoff; DE.

Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

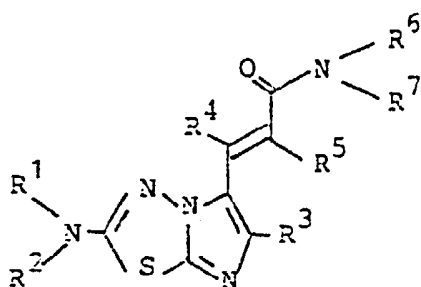
Fremgangsmåde til fremstilling af imidazothiadiazolalkencarboxylsyreamider

SAMMENDRAG

1132-83

Fremgangsmåde til fremstilling af imidazothiadiazolalkencarboxylsyreamider.

Imidazothiadiazolalkencarboxylsyreamider med den alme-
ne formel I



(I)

hvori

- R^1 betyder hydrogen, aryl, substitueret aryl eller en ligekædet eller cyclisk, mættet eller umættet alifatisk carbonhydridgruppe, som eventuelt er afbrudt af O, S, N, N-alkyl, N-aryl eller N-aralkyl, og som eventuelt er substitueret ved hydroxy, alkoxy, alkyl, trifluormethyl, halogen, phenyl, alkoxycarbonyl eller dialkylamino, hvor begge alkylgrupperne eventuelt sammen med nitrogenatomet danner en 5- til 7-leddet ring, som eventuelt indeholder et heteroatom valgt blandt O, S, NH eller N-alkyl, og hvor disse førnævnte alkyl- og phenylgrupper på deres side eventuelt er substitueret med halogen, trifluormethyl, alkyl, aryl, aralkyl, alkoxy, alkylmercapto eller SO_2 -alkyl,
- R^2 betyder hydrogen eller gruppen CXR^8 , hvor R^8 har den for R^1 angivne betydning og er ens med eller forskellig fra R^1 , og hvor X betyder oxygen, svovl eller gruppen NR^9R^{10} , hvor R^9 og R^{10} er ens eller forskellige og hver især har betydningerne fra R^1 og er ens med eller forskellige fra R^1 , eller betyder gruppen SO_nR^{11} , hvor n betyder 1 eller 2, og R^{11} har den for R^1 angivne betydning og er ens med eller forskellig fra R^1 , eller
- R^1 og R^2 tilsammen betyder en gruppe med den almene formel $=C(R^{12})(Y-R^{13})$, hvor Y betyder oxygen, svovl, NH eller N-alkyl, og R^{12} og R^{13} hver især har den for R^1 angivne betydning, er indbyrdes ens eller forskellige og ens med eller forskellige fra R^1 , og eventuelt tilsammen og indbefattet $=C-Y$ danner en 5- til 7-leddet ring, som eventuelt indeholder et heteroatom valgt blandt O, S, NH eller N-alkyl,
- R^3 har den for R^1 angivne betydning og er ens med eller forskellig fra R^1 , eller betyder furyl, phenyl, thienyl, pyrimidyl, pyrazinyl, chinolinyl, isochinolinyl eller pyridyl, hvor ringene eventuelt er substitueret med 1, 2 eller 3 ens eller forskellige substituenten valgt blandt alkyl, aryl, alkoxy, halogen, nitro, trifluormethyl, SO_n -alkyl (n = 0, 1 eller 2) eller NR^9R^{10} , hvor R^9 og R^{10}

har de ovenfor anførte betydninger,

R^4 betyder hydrogen, trifluormethyl eller alkyl,

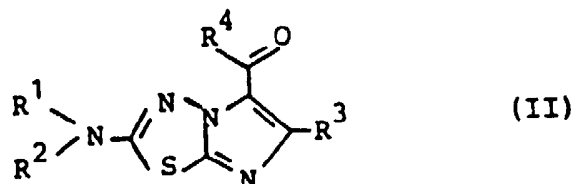
R^5 betyder hydrogen, alkyl, cyano, halogen, nitro, SO_n -alkyl ($n = 0, 1$ eller 2) eller CXR^8 , hvor X og R^8 har de ovennævnte betydninger, og

R^6 og R^7 hver især har den for R^1 angivne betydning og er ens med eller forskellige fra R^1 eller sammen med nitrogenatomet danner en 3- til 8-leddet mættet eller umættet ring, som eventuelt indeholder en eller to yderligere heteroatomer valgt blandt oxygen, svovl eller nitrogen, hvor nitrogenatomet eventuelt er substitueret med hydrogen, alkyl, aryl eller aralkyl, og hvor denne 3- til 8-leddede ring eventuelt er substitueret med 1, 2, 3 eller 4 ens eller forskellige substituenten valgt blandt alkyl, aryl, aralkyl, halogen, alkoxy-carbonyl, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, alkoxy eller trifluormethyl, eller hvor denne ring kan være kondenseret med en eventuelt substitueret aromatisk ring, samt deres stereoisomere former af forskellige enantiomere, diastomereomere og E/Z-isomere samt deres pharmaceutisk uskadelige syreadditionssalte,

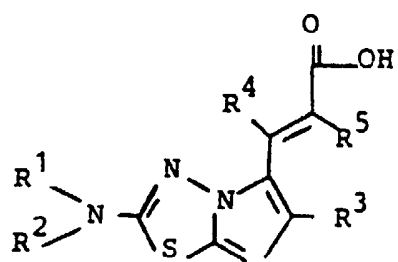
fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Forbindelser med formel I har stærke biologiske virkninger og finder anvendelse i lægemidler, især i antihypertensiva, diuretika og uricosurica.

Ved fremstilling af forbindelserne med formel I forekommer ny mellemprodukter, nemlig dels carbonylforbindelser med den almene formel



og dels alkencarboxylsyre med den almene formel VI



(VI)