

C 07 D 409

Ans.nr.: 4224/85

Indleveret: 18 sep 1985

Løbedag: 18 sep 1985

Alm. tilgængelig: 20 mar 1986

Prioritet: 19 sep 1984 US 652372

20 jun 1985 US 747194

*PFIZER INC; New York, US.

Opfinder: Saul Bernard *Kadin; US.

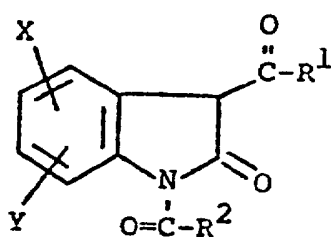
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

1,3-Diacyl-2-oxindol-forbindelser og mellemprodukter ved deres fremstilling samt farmaceutiske præparater

SAMMENDRAG

4224-85

1,3-Diacyl-2-oxindol-forbindelser med formlen

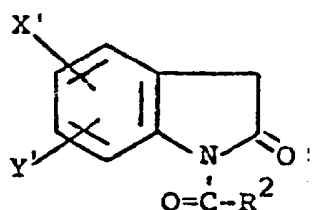


hvor X er H, F, Cl, Br, CF₃, alkyl, cycloalkyl, alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, nitro, phenyl, alkanoyl, benzoyl, thenoyl, alkanamido, benzamido eller N,N-dialkylsulfamoyl, Y er H, F, Cl, Br, CF₃, alkyl, cycloalkyl, alkoxy eller alkylthio, R¹ er alkyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, phenylalkyl, phenoxyalkyl, (thiophenoxy)alkyl, naphthyl eller en eventuelt alkylsubstitueret heterocyclyl- eller heterocyclylalkyl-gruppe, hvor phenylgruppen og phenyldelen af phenylal-

kyl- og phenoxyalkylgruppen eventuelt er substitueret med F, Br, Cl, CF_3 , alkyl eller alkoxy, og R^2 er alkyl, er inhibitorer for enzymerne cyclooxygenase (CO) og lipoxygenase (LO).

Forbindelserne I og deres farmaceutisk acceptable base-salte er nyttige som analgetiske midler og som anti-inflammatoriske midler hos pattedyr. De er af særlig værdi til akut indgivning for at lette smerte hos mennesker, der kommer sig fra kirurgi eller trauma, og også til kronisk indgivning til mennesker for at afhjælpe symptomerne på kroniske sygdomme som rheumatoid arthritis og osteoarthritis.

1-Acyl-2-oxindol-forbindelserne med formlen



hvor X' og Y' er H, F, Cl eller CF_3 , idet de ikke begge er H, er nyttige som mellemprodukter ved fremstilling af forbindelserne I.