

C 07 D 461

Ans.nr.: 2629/82

Indleveret: 11 jun 1982

Løbedag: 11 jun 1982

Alm. tilgængelig: 13 dec 1982

Prioritet: 12 jun 1981 HU 1753/81

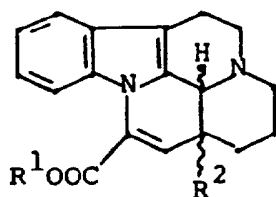
*RICHTER GEDEON VEGYESZETI GYAR
RT.; Budapest, HU.Opfinder: Csaba *Szantay; HU, Lajos *Szabo;
HU, Gyoergy *Kalaus; HU, Janos *Kreidl; HU,
Gyoergy *Visky; HU, Andras *Nemes; HU, Ma-
ria *Farkas; HU.

Fuldmægtig: Kontor for Industriel Eneret

Fremgangsmåde til fremstilling af apovin-
caminsyreestere

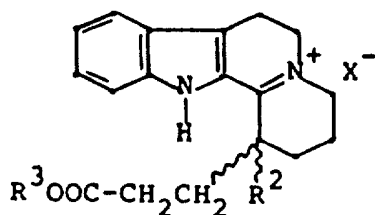
Sammendrag

2629-82

Fremgangsmåde til fremstilling af apovincaminsyreestere.Racemiske cis- og/eller trans-apovincaminsyreestere
med formlen I

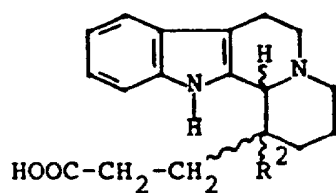
I

hvor R^1 og R^2 er alkyl og de tilsvarende optisk aktive deri-
vater deraf fremstilles ved reduktion af en forbindelse med
formlen V



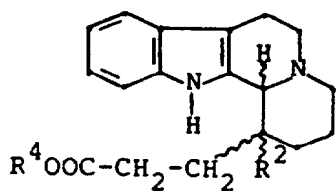
V

hvorpå man eventuelt hydrolyserer under alkaliske betingelser til dannelse af en forbindelse med formelen III



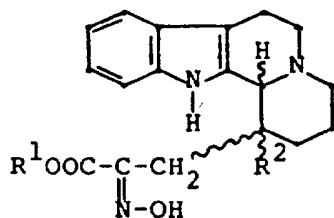
III

hvilken forbindelse forestres til en forbindelse med formelen VI



VI

hvorefter man behandler med t-butylnitrit i et aromatisk kulbrinteopløsningsmiddel og derpå med alkalimetalt-alkoholat og eventuelt med et aprotisk dipolært opløsningsmiddel og om ønsket med en alkanol med formelen R^5-OH , hvor R^5 er alkyl, hvorpå den vundne forbindelse med formelen II



II

behandles med en koncentreret, ikke flygtig syre i et inaktivt organisk opløsningsmiddel.

Racemiske og/eller optisk aktive forbindelser med formelen I, der har velkendte farmakologiske egenskaber såsom vasodilaterende virkning, vindes i gode udbytter.

Racemiske og/eller optisk aktive forbindelser med formelen II er hidtil ukendte mellemprodukter.