

C 07 F 9

Ans.nr.: 4489/83

Indleveret: 29 sep 1983

Løbedag: 29 sep 1983

Alm. tilgængelig: 31 mar 1984

Prioritet: 30 sep 1982 US 431933

07 feb 1983 US 464274

*SYNTEX (USA) INC.; Palo Alto, US.

Opfinder: Julien P.H. *Verheyden; US, John C.

*Martin; US.

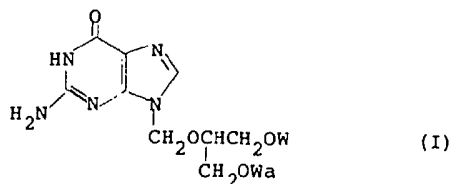
Fuldmægtig: Th. Ostenfeld Patentbureau A/S

1-Monophosphatester, 1,3-bisphosphatester
og cykliske phosphatester af 9-(1,3-dihydroxy-2-propoxymethyl)guanin som antivirale midler

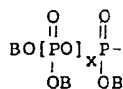
4489-83

SAMMENDRAG

Forbindelser med formelen:

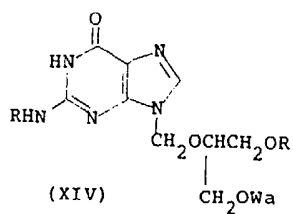


hvor W er hydrogen eller $\text{BO}[\text{PO}]_x\text{P}-$, og Wa er

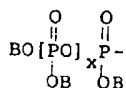


eller W sammen med Wa danner $\text{BO}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{||}}{\text{P}}}-$, hvori B er hydrogen eller en farmaceutisk acceptabel modion, og x er 0, 1 eller 2, fremstilles ved, at man

a) omsætter en forbindelse med formlen:

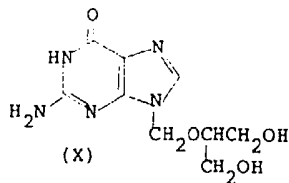


hvori R er benzoyl eller en triphenylmethylgruppe med en stærk base til dannelse af en forbindelse med formel (I), hvori W er hydrogen, og Wa er:

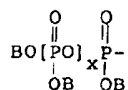


hvori B er en natriumion, og x er 0, 1 eller 2, eller

b) omsætter en forbindelse med formlen



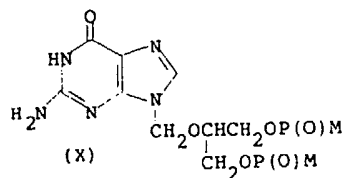
med et phosphoryleringsmiddel til dannelse af en forbindelse med formel (I), hvori W og Wa er:



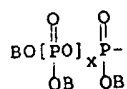
4489-83

hvor B er en natriumion, og x er 0, eller

c) omsætter en forbindelse med formelen:

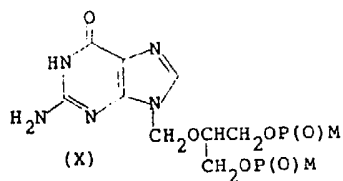


hvor M er 4-morpholino med t-butylammoniumphosphat til dannelse af en forbindelse med formel (I), hvor W og Wa er:

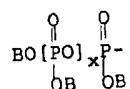


hvor B er hydrogen, og x er 1, eller

d) omsætter en forbindelse med formelen:

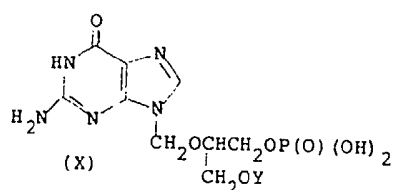


hvor M er 4-morpholino med tributylammoniumpyrophosphat til dannelse af en forbindelse med formel (I), hvor W og Wa er:



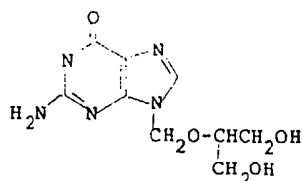
hvor B er hydrogen, og x er 2, eller

e) omsætter en forbindelse med formelen:



hvor Y er en lipofilisk amin med et kondensationsmiddel til dannelse af en forbindelse med formel (1), hvori W sammen med Wa

er $\text{BO}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{||}}{\text{P}}}<$, hvori B er kalium eller trialkylammonium, eller
f) omsætter en forbindelse med formelen:



med et phosphoxyleringsmiddel til dannelse af en forbindelse med

formel (1), hvori W sammen med Wa danner $\text{BO}-\overset{\text{O}}{\underset{\text{||}}{\text{P}}}<$, hvori B er hydrogen eller en farmaceutisk acceptabel modion, eller

- g) eventuelt omdanner saltet til den frie syre, eller
- h) eventuelt omdanner et salt til et andet salt.

Forbindelserne (1) udviser antiviral aktivitet.