



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

834215

(11) (21) Patentihakemus-Patentansökan

(51) Kv.lk.³/Int.Cl.³ C 07 D 213/64, 211/86, 401/04

17.11.83

(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag

(23) Alkupäivä-Löpdag

(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig

19.5.84

(86) Kv. hakemus-Int. ansökan

18.11.82 US 442,623

22.11.82 US 443,249

(30) Etuoikeus-Prioritet

(71) Hakija/Sökande: Sterling Drug Inc., 90 Park Avenue, New York, N.Y., USA

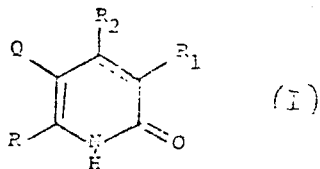
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Leshner, George Yohe 2. Singh, Baldev 3. Carabateas, Philip Michael

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Sydänlääkkeenä käyttökelpoisia 2(1H)-pyridinoneja sekä niiden valmistus. 2(1H)-pyridinoner och deras framställning, användbara som hjärmediciner.

(57) Tiivistelmä

Keksinnön kohteena on 3,4-dihydro-3-R₁-4-R₂-5-Q-6-R-2(1H)-pyridinoneja (I),



jossa R₁ ja R₂ kumpikin on vety tai metyyli, R on alempi alkyyli ja Q on 4(tai 3)-hydroksifenyyli, 4(tai 3)-metoksifenyyli, 4(tai 3)-pyridinyyli tai 4(tai 3)-pyridinyyli, jossa on yksi tai kaksi alempaa alkyyli-substituenttia, tai niiden happoadditiosuoloja, samoin kuin vastaavia 3-R₁-4-R₂-5-Q-6-R-2(1H)-pyridinoneja, joissa ainakin toinen R₁:stä ja R₂:sta on metyyli. Näillä yhdisteillä on käyttöä sydänlääkkeinä, kun Q on 4(tai 3)-hydroksifenyyli, 4(tai 3)-pyridinyyli tai 4(tai 3)-pyridinyyli, jossa on yksi tai kaksi alempaa alkyyli-substituenttia. Näitä yhdisteitä valmistetaan butaaninitriileistä, butanoaateista, akryyliamideista tai alkanonien ja asetoasetamidin seoksista muuttaen valinnaisesti saadut 3,4-dihydro-yhdisteet 3,4-tyydyttämättömiksi yhdisteiksi kuumentamalla rikin kanssa inertissä liuotuksessa ja muuttamalla metoksifenyyli-yhdisteet hydroksifenyyli-yhdisteiksi.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser 3,4-dihydro-3-R₁-4-R₂-5-Q-6-R-2(1H)-pyridinoner (I) där R₁ och R₂ båda är väte eller metyl, R är lägre alkyl och Q är 4(eller 3)-hydroksifenyl, 4(eller 3)-metoksifenyl, 4(eller 3)-pyridinyl eller 4(eller 3)-pyridinyl som har en eller två lägre alkylsubstituentier, eller syraadditionssalter därav såväl som motsvarande 3-R₁-4-R₂-5-Q-6-R-2(1H)-pyridinoner, där minst en av R₁ och R₂ är metyl. Föreningarna har användning som hjärmedicin då Q är 4(eller 3)-hydroksifenyl, 4(eller 3)-pyridinyl eller 4(eller 3)-pyridinyl med en eller två lägre alkylsubstituentier. Föreningarna framställs från butannitriler, butanoater, akrylamider eller blandningar av alkanoner och acetoacetamid, med valfri konversion av de erhållna 3,4-dihydroföreningarna till 3,4-omättade föreningar medelst hettning med svavel i ett inert lösningsmedel och konversion av metoksifenyl-föreningarna till hydroksifenylföreningar.