

C 07 D 253

Ans.nr.: 2016/84

Indleveret: 18 apr 1984

Løbedag: 18 apr 1984 840418

Alm. tilgængelig: 23 okt 1984

Prioritet: 22 apr 1983 JP 72013/83

*FUJISAWA PHARMACEUTICAL CO. LTD.;

Osaka, JP.

Opfinder: Tsutomu *Teraji; JP, Youichi *Shioka-
wa; JP, Kazuo *Okumura; JP, Yoshinari *Sato;
JP.

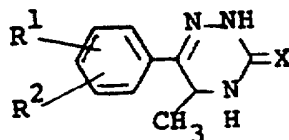
Fuldmægtig: Plougmann & Vingtoft Patentbu-
reau

Triazinderivater

SAMMENDRAG

2016-84

Triazinderivater med den almene formel I



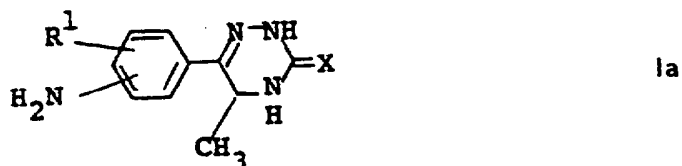
hvor R^1 betegner hydrogen eller halogen;

R^2 betegner hydroxy, beskyttet hydroxy, amino, cyano, mer-
capto, lavere alkylthio, arylthio, sulfamoyl, lavere alkyl-
sulfonlamino, lavere alkylureido, arylureido, lavere alkyl-
thioureido, arylthioureido, lavere alkenoylamino, lavere
alkoxycarbonylamino, lavere alkoxy(thiocarbonyl)thio eller
cyclisk eller acyclisk alkanoylamino, hvor den cycliske og
acycliske alkanoylaminogruppe kan have en substituent valgt
blandt lavere alkoxy, aryl, hydroxyaryl og beskyttet hydr-
oxyaryl; og

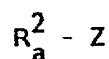
X betegner O eller S;

og farmaceutisk acceptable salte deraf fremstilles ved, at

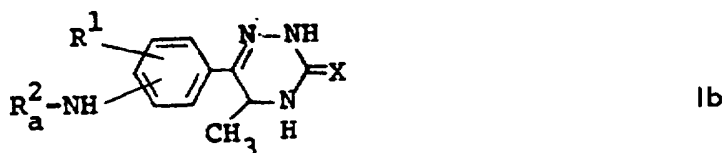
a) en forbindelse med den almene formel Ia



eller et salt deraf omsættes med en forbindelse med den almene formel

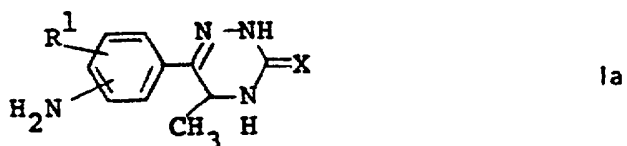


(hvor R_a^2 betegner lavere alkylsulfonyl, lavere alkenoyl, lavere alkoxycarbonyl eller cyclisk eller acyclisk alkanoyl, hvor den cycliske og acycliske alkanoylgruppe kan have en substituent valgt blandt lavere alkoxy, aryl, hydroxyaryl og beskyttet hydroxyaryl, og Z betegner hydroxy eller en syrerest),
eller et salt deraf til dannelselse af en forbindelse med den almene formel Ib



eller et salt deraf, eller

b) en forbindelse med den almene formel Ia



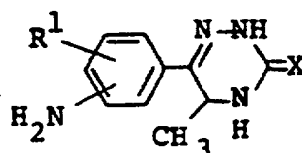
eller et salt deraf omsættes med isocyanat eller isothiocyanat, der er substitueret med alkyl eller aryl, til dannelselse af en forbindelse med den almene formel Ic



(hvor R_b^2 betegner lavere alkylureido, arylureido, lavere alkylthio-ureido eller arylthioureido)

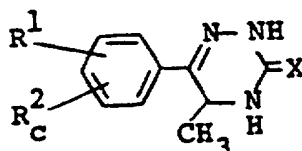
eller et salt deraf, eller

c) en forbindelse med den almene formel Ia



Ia

eller et salt deraf omsættes med salpetersyrning eller et salt deraf og derefter ved substitutionsreaktion af diazoniumsaltet danner en forbindelse med den almene formel Id

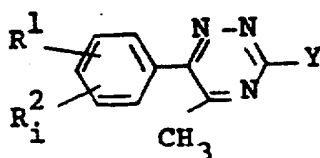


Id

(hvor R_c^2 betegner hydroxy, cyano, mercapto, lavere alkylthio, arylthio eller lavere alkoxy(thiocarbonyl)thio),

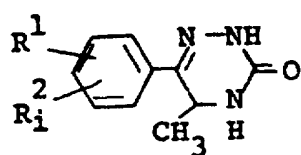
eller et salt deraf, eller

d) en forbindelse med den almene formel II



II

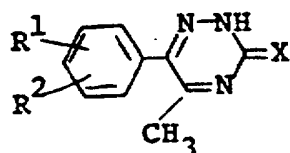
(hvor R_i^2 betegner hydroxy, beskyttet hydroxy, amino, cyano, mercapto, lavere alkylthio, arylthio, sulfamoyl, lavere alkylsulfonylamino, lavere alkylureido, arylureido, lavere alkylthioureido, arylthioureido, lavere alkenoylamino, eller cyclisk eller acyclisk alkanoylamino, hvor den cycliske og acycliske alkanoylamino gruppe kan have en substituent valgt blandt lavere alkoxy, aryl, hydroxyaryl og beskyttet hydroxyaryl; og Y betegner en fraspaltelig gruppe),
eller et salt deraf behandles med en base og derefter reduceres til dannelsen af en forbindelse med den almene formel Ie



1e

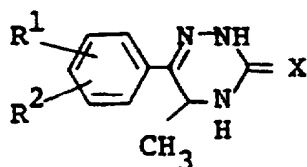
eller et salt deraf, eller

e) en forbindelse med den almene formel 1f



1f

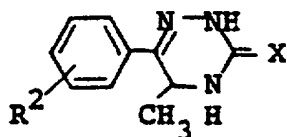
eller et salt deraf reduceres til dannelse af en forbindelse med den almene formel 1



1

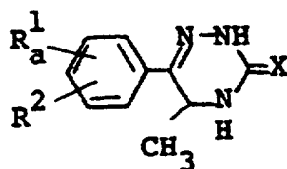
eller et salt deraf, eller

f) en forbindelse med den almene formel 1g



1g

eller et salt deraf omsættes med et halogeneringsmiddel til dannelse af en forbindelse med den almene formel 1h

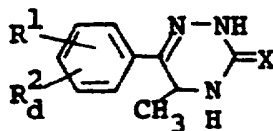


1h

(hvor R_a^1 betegner halogen)
eller et salt deraf, eller

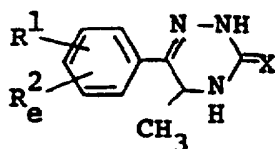
fortsættes

g) en forbindelse med den almene formel li



li

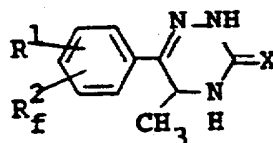
(hvor R_d^2 betegner beskyttet hydroxy eller cyclisk eller acyclisk alkanoylamino, hvor den cycliske og acycliske alkanoylamino gruppe kan have en substituent valgt blandt lavere alkoxy, aryl, hydroxyaryl og beskyttet hydroxyaryl)
 eller et salt deraf underkastes en elimineringsreaktion af beskyttelsesgruppen til dannelse af en forbindelse med den almene formel lj



lj

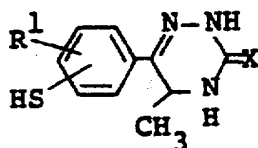
(hvor R_e^2 betegner hydroxy, amino eller cyclisk eller acyclisk alkanoylamino, som er substitueret med hydroxyaryl)
 eller et salt deraf, eller

h) en forbindelse med den almene formel lk



lk

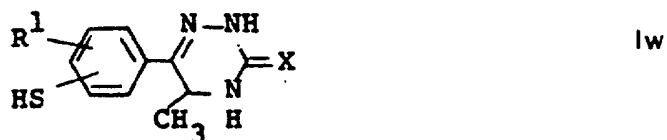
(hvor R_f^2 betegner lavere alkoxy(thiocarbonyl)thio)
 eller et salt deraf ved solvolyse danner en forbindelse med den almene formel lw



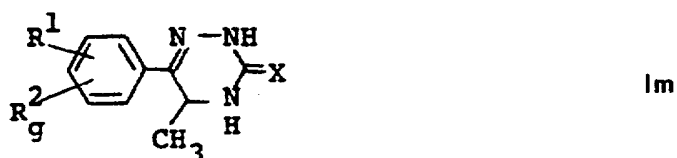
lw

eller et salt deraf, eller

i) en forbindelse med den almene formel Iw



eller et salt deraf omsættes med et alkyleringsmiddel til dannelse af en forbindelse med den almene formel Im

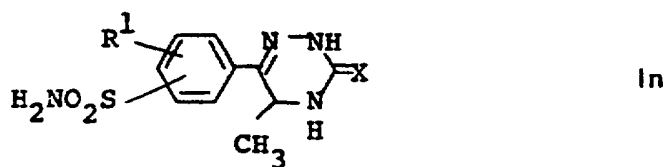


(hvor Rᵍ² betegner lavere alkylthio)
eller et salt deraf, eller

j) en forbindelse med den almene formel III



(hvor Rᵍ² betegner halogensulfonyl)
eller et salt deraf omsættes med ammoniak til dannelse af en forbindelse med den almene formel In



eller et salt deraf.

Forbindelserne er nyttige til behandling af hypertension, thrombose og ulcer hos mennesker og dyr.