

C 07 D 213

Ans.nr.: 1423/82

Indleveret: 29 mar 1982

Løbedag: 29 mar 1982

Alm. tilgængelig: 01 okt 1982

Prioritet: 30 mar 1981 US 248840

08 sep 1981 US 300294

*STERLING DRUG INC.; New York, US.

Opfinder: George *Leshner; US, Chester Joseph

*Opalka Jr.; US, Donald Frederick *Page; US.

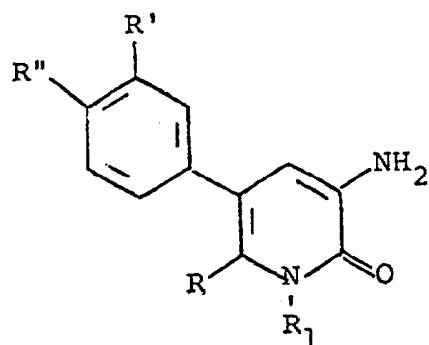
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Fremgangsmåde til fremstilling af
3-amino-5-(substituerede)-2(1H)-pyridinoner

SAMMENDRAG

1423-82

1-R₁-3-amino-5-(3-R'-4-R''-phenyl)-6-R-2(1H)pyridinoner
eller salte heraf med formelen I



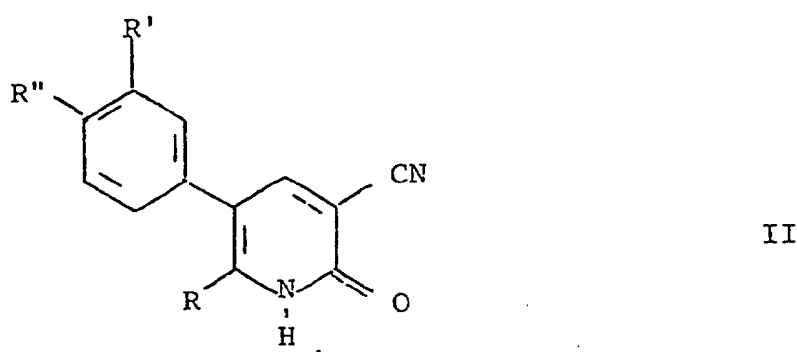
I

hvor R₁ er hydrogen, alkyl eller hydroxyalkyl, R er hydrogen eller alkyl, og R' og R'' er hver især hydrogen, amino eller hydroxy, idet mindst én af R' eller R'' ikke er hydrogen, fremstilles ved omsætning af et tilsvarende 1,2-dihydro-2-oxo-5-(3-R'-4-R''-phenyl)-6-R-nicotinamid

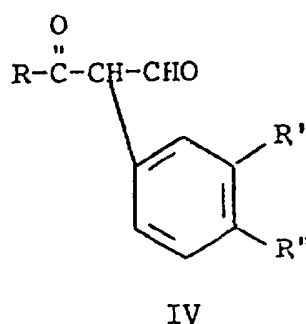
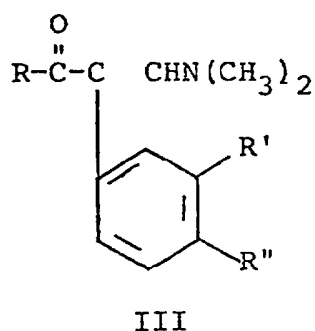
eller en forbindelse, hvor R' og/eller R'' i stedet for hydrogen og/eller amino er henholdsvis alkoxy og/eller nitro, med et reagens til omdannelse af carbamyl til amino, og dersom der er opnået en forbindelse med formel I, hvori R' og/eller R'' er alkoxy og/eller nitro, omsættes denne med et reagens til omdannelse af alkoxy til hydroxy og/eller med et reagens til omdannelse af nitro til amino, hvorefter en fremstillet fri base eventuelt omdannes til syreadditionssaltet.

Forbindelserne I er lægemidler med cardiotonisk virkning.

1-R₁-1,2-dihydro-2-oxo-5-(substitueret phenyl)-6-R-nicotinonitril med formelen II



hvor R er hydrogen eller alkyl, R'' er hydroxy, og R' er hydrogen, amino, nitro eller hydroxy, bortset fra, at R' ikke er hydroxy, hvis R er hydrogen, eller et syreadditionssalt heraf, hvis R' er amino, fremstilles ved omsætning af en forbindelse med formel III eller IV



med α -cyanoacetamid, idet R er hydrogen eller alkyl, R" er hydroxy eller alkoxy, og R' er hydrogen, amino, nitro, hydroxy eller alkoxy, bortset fra, at R' ikke er hydroxy eller alkoxy, hvis R er hydrogen, og hvis der fremstilles en forbindelse med formel II, hvor R' og/eller R" begge er alkoxy, omsættes denne med et reagens til omdannelse af alkoxy til hydroxy, og en fremstillet fri base, hvor R' er amino, omdannes eventuelt til syreadditionssaltet.

Forbindelserne II er mellemprodukter og også lægemidler med cardiotonisk virkning.

1-R₁-3-amino-5-(3-R'-4-R"-phenyl)-6-R-2(1H)-pyridinon med formel I eller syreadditionssalte heraf, hvori R₁ er hydrogen, alkyl eller hydroxyalkyl, R er hydrogen eller alkyl, R' og R" er hver især hydrogen eller methoxy, idet mindst den ene af R' eller R" er methoxy, er mellemprodukter for fremstilling af forbindelser med formlen I, hvori mindst én af R' eller R" er hydroxy.

