

C 07 D 213

Ans.nr.: 3460/86

Indleveret: 21 jul 1986

Løbedag: 10 okt 1980

Stamansøgning nr.: 4282/80

Alm. tilgængelig: 21 jul 1986

Prioritet: 11 okt 1979 FR 7925370

*SANOFI S.A.; Paris, FR.

Opfinder: Henri *Demarne; FR, Claude *Bernhart; FR, Jacqueline *Lansen; FR.

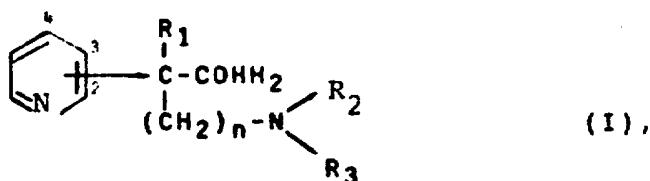
Fuldmægtig: Firmaet Chas. Hude

Fremgangsmåde til fremstilling af pyridinderivater, som især har en antiarytmisk virkning og modvirker blodpladeaggregation

SAMMENDRAG

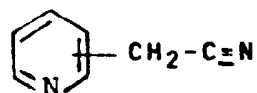
3460-86

Pyridinderivater med formlen:

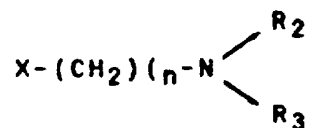


hvor i pyridinets substituent er i stillingerne 2, 3 eller 4 til pyridinkernen, R_1 betegner en ligekædet eller forgrenet, mættet eller umættet alkylgruppe med 1 - 10 carbonatomer eller en alicyklisk gruppe, R_2 og R_3 betegner en forgrenet alkylgruppe med 3 - 6 carbonatomer eller en alicyklisk gruppe, eller de to grupper R_2 og R_3 sammen med nabonitrogenatomet danner en morpholino- eller piperidinogruppe, som eventuelt har endnu et heteroatom og kan bære en eller flere substituent, n er lig med 2, 3 eller 4, samt saltene af nævnte derivater med mineralsyrer eller organiske syrer, især farmaceutisk acceptable syrer, fremstilles ved at med gennemfører følgende behandlinger:

a) et pyridylacetonitril med formlen:



underkastes en alkyleringsreaktion med en forbindelse med formlen:



hvor X er et halogen,

b) det opnåede produkt underkastes en anden alkyleringsreaktion ved hjælp af en forbindelse med formlen R_1X , hvor R_1 er en umættet alkylgruppe,

c) hvorpå man på i og for sig kendt måde hydrolyserer det opnåede produkts nitrilfunktion, således at man opnår det tilsvarende amid,

d) det således opnåede produkt med formlen (I) eventuelt omdannes til et salt ved reaktion med en syre.