



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

- (11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 861573
 (51) Kv.Ik.⁴/Int.Cl.⁴ C 07 D 249/08
 (22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 14.04.86
 (23) Alkuperäivä - Löpdag
 (41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 19.10.86
 (86) Kv. hakemus - Int. ansökan
 (30) Etuoikeus - Prioritet 18.04.85 CH 1663/85-5

(71) Hakija/Sökande: Ciba-Geigy AG, Basel, Sveitsi

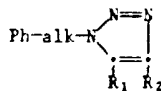
(72) Keksijä/Uppfinnare: Meier, Rene

(74) Asiamies/Ombud: Ant-Wuorinen

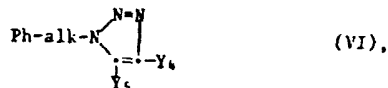
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä fluorattujen bent-syyliatriatsoliyhdisteiden valmistamiseksi. Förfarande för framställning av fluorerade bensyltriazolföreningar.

(57) Tiivistelmä

Uusilla fluoraatuilla kaavan I



mukaisilla 1-(α -fenyylialkyyl)-1H-1,2,3-triatsoliyhdisteillä, missä kaavassa Ph merkitsee o-asemassa fluorilla ja mahdollisesti lisäksi vähintään yhdellä muulla halogeeniatomilla substituotua fenyylitähdettä, alk merkitsee alempialkylideeniä, R₁ merkitsee vetyä, alempialkyylia tai substituomatonta tai alempialkanoyylillä tai alempialkyyllillä substituotua karbamyyliryhmää ja R₂ merkitsee substituomatonta tai alempialkanoyylillä tai alempialkyyllillä substituotua karbamyyliryhmää, on antikonvulsiivisia ominaisuuksia ja niitä voidaan käyttää lääkeaineina. Ne valmistetaan siten, että kaavan VI

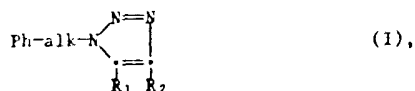


mukainen yhdiste, jossa Y₄ merkitsee esteröityä karboksia ja Y₅ merkitsee vetyä, alempialkyylia tai samoin esteröityä karboksia, saatetaan reagoimaan ammoniakkin tai dialempialkyyliamiinin ylimäärän kanssa ja haluttaessa alempialkanoyloidaan menetelmän mukaisesti saatava yhdiste, jossa R₂ ja mahdollisesti R₁ merkitsee substituomatonta karbamyylia.

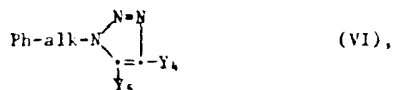
Jatkuu seur. sivulla
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

Nya fluorerade 1-(^o-fenylalkyl)-1H-1,2,3-triazolföreningar med formeln I



där Ph betyder en i o-ställning med fluor och eventuellt vidare med åtminstone en ytterligare halogenatom substituerad fenylrest, alk betyder lågalkyliden, R₁ betyder väte, lågalkyl eller en osubstituerad eller med lågalkanoyl eller lågalkyl substituerad karbamylgrupp och R₂ betecknar en osubstituerad eller med lågalkanoyl eller lågalkyl substituerad karbamylgrupp, har antikonvulsiva egenskaper och de kan användas som läkemedel. De framställs så, att en förening med formeln VI



där Y₄ betyder förestrad karboxi och Y₅ betyder väte, lågalkyl eller också förestrad karboxi, omsätts med ett överskott av ammoniak eller dilågalkylamin och om önskas, i en enligt förfarandet erhållen förening, där R₂ och eventuellt R₁ betyder osubstituerad karbamyl, R₂ och eventuellt R₁ lågalkanoyleras.