

C 07 D 513

Ans.nr.: 0120/84

Indleveret: 11 jan 1984

Løbedag: 11 jan 1984

Alm. tilgængelig: 13 jul 1984

Prioritet: 12 jan 1983 GB 8300728

*FARMITALIA CARLO ERBA S.P.A.; Milano, IT.

Opfinder: Gianfederico *Doria; IT, Carlo *Passarotti; IT, Maria Luisa *Corno; IT.

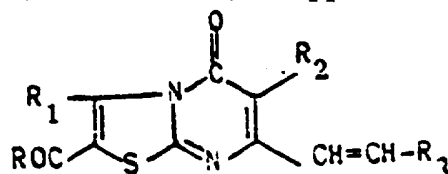
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co

Substituerede carboxy-thiazolo(3,2-a)pyrimidinderivater samt fremgangsmåde til fremstilling heraf

S A M M E N D R A G

120-84

Carboxy-thiazolo[3,2-a]pyrimidinderivater med formlen



hvor R er a) hydroxy,

b) en C₁₋₆-alkoxygruppe, der eventuelt er substitueret

med en substitueret pyridylring eller en $\begin{matrix} R_4 \\ \diagdown \\ -N \\ \diagup \\ R_5 \end{matrix}$

gruppe, hvor R₄ og R₅ hver er et hydrogenatom eller en C₁₋₆-alkylgruppe, eller R₄ og R₅ danner sammen med det nitrogenatom, hvortil de er knyttet, en usubstitueret piperidino- eller N-pyrrolidinylring, eller en morpholinoring, der eventuelt er substitueret med en eller to C₁₋₄-alkylgrupper, eller en N-piperazinylring, der eventuelt er substitueret med en substituent, der er C₁₋₆-alkyl, pyridyl eller phenyl,

c) $-N \begin{matrix} \diagup R_4 \\ \diagdown R_5 \end{matrix}$, hvor R_4 og R_5 er som defineret ovenfor,

d) $-NH-(CH_2)_m-N \begin{matrix} \diagup R_4 \\ \diagdown R_5 \end{matrix}$, hvor m er 1, 2 eller 3, og R_4 og

R_5 er som defineret ovenfor, eller

e) $-NR_6-(CH_2)_n-R_7$, hvor R_6 er hydrogen eller C_{1-6} -alkyl, n er 0, 1, 2 eller 3, og R_7 er en umættet heterocyclisk ring med et eller flere heteroatomer, der er nitrogen eller svovl, eventuelt substitueret med en eller to substituentter, der er halogen, C_{1-6} -alkyl eller C_{1-6} -alkoxy,

R_1 er et hydrogenatom, C_{1-6} -alkyl, en usubstitueret pyridylring eller en phenylring, der eventuelt er substitueret med en eller to substituentter, der er halogen, C_{1-6} -alkyl eller C_{1-6} -alkoxy,

R_2 er et hydrogen- eller et halogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe,

R_3 er en thienyl- eller pyridylring, der hver eventuelt er substitueret med C_{1-6} -alkyl, eller R_3 er en gruppe

med formelen $-\begin{matrix} R_8 \\ | \\ \text{C}_5\text{R}_9 \\ / \backslash \\ \text{C}_5\text{R}_{10} \end{matrix}$, hvor R_8 , R_9 og R_{10} hver er

hydrogen, halogen, hydroxy, formyloxy, C_{2-4} -alkanoyloxy, nitro, amino, formylamino, C_{2-4} -alkanoylamino, trihalogen- C_{1-6} -alkyl eller en $-(O)_p-R_{11}$ -gruppe, hvor p er 0 eller 1, og R_{11} er en C_{1-6} -alkyl- eller C_{3-4} -alkenylgruppe,

eller et farmaceutisk acceptabelt salt deraf fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne med formelen I har anti-allergisk virkning og er derfor anvendelige til forebyggelse og behandling af alle lidelser af allergisk oprindelse, f.eks. bronchial asthma, allergisk rhinitis, høfeber, urticaria og dermatosis.