



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 870629
(51) Kv.lk. 4/Int.cl. 4 C 07 D 471/04
// (C 07 D 471/04, 209:00, 221:00)
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 13.02.87
(23) Alkuperäpäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 15.08.87
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 14.02.86 FR 8602045

(71) Hakija/Sökande: *Sanofi*, 40 Avenue George V, Paris, Ranska

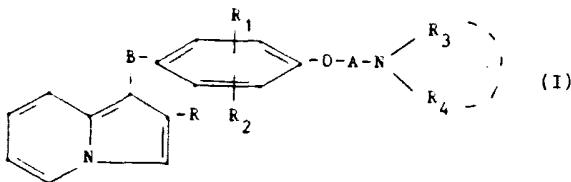
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Gubin, Jean 2. Chatelain, Pierre 3. Descamps, Marcel 4. Nisato, Dino

(74) Asiamies/Ombud: Borenius

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmät ja välituotteet farmakologisesti aktiivisten indolitsiinijohdannaisten valmistamiseksi. Förfaranden och mellanprodukter för framställning av farmakologiskt aktiva indozilinderivat.

(57) **Tiivistelmä**

Keksintö kohdistuu menetelmiin ja välituotteisiin uusien indolitsiinijohdannaisten valmistamiseksi, joilla johdannaisilla on yleinen kaava



missä

B tarkoittaa -S-, -SO- tai -SO₂-ryhmää,

R tarkoittaa vetyä, suoraketjuista tai haaroittunutta alkyylia, korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävää sykloalkyylia, tai fenyyli-ryhmää, joka on substituutiton tai substituutunut yhdellä tai useammalla samanlaisella tai erilaisella substituentilla, joka valitaan halogeeniatomien, alempien alkyyliryhmien, alempien alkoksiryhmien ja nitroryhmien joukosta,

R₁ ja R₂, jotka ovat sama tai eri ryhmä, tarkoittavat toisistaan riippumatta vetyä, metyyliä tai etyyliä, tai halogeenia,

A tarkoittaa 2...5 hiiliatomia käsittävää suoraketjuista tai haaroittunutta alkyleenia tai 2-hydroksipropyleenia,

R₃ tarkoittaa suoraketjuista tai haaroittunutta alkyylia tai radikaalia, jolla on kaava: Alk-R₅, missä Alk tarkoittaa yksinkertaista sidosta tai suoraketjuista tai haaroittunutta, 1...5 hiiliatomia käsittävää alkyleenia, ja R₅ tarkoittaa pyridyyli-, fenyyli-, 2,3-metyleenidioksifenyyli- tai 3,4-metyleenidioksifenyyliä tai fenyyli-ryhmää, joka on substituutunut yhdellä tai useammalla samanlaisella tai erilaisella substituentilla, jotka valitaan halogeeniatomien, alempien alkyyliryhmien tai alempien alkoksiryhmien joukosta,

Jatkuu seur. sivulla
Forts. nästa sida

R₄ tarkoittaa vetyä tai alkyyliä, tai

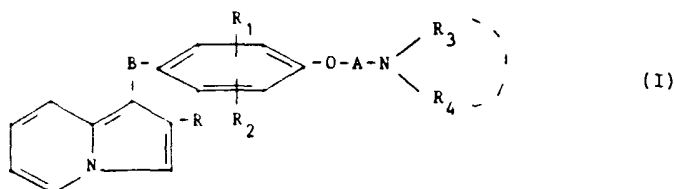
R₃ ja R₄ tarkoittavat yhdessä 3...6 hiiliatomia käsittävää alkyleeni- tai alkenyleenia, joka on valinnaisesti substituutunut fenyyllillä, tai jonka valinnaisesti katkaisee -O-, -NH-, -N= tai -N-R₆, missä R₆ tarkoittaa alempaa alkyyliä tai fenyyliä,

sekä myös näiden johdannaisten farmaseuttisesti hyväksyttävien suolojen valmistamiseksi.

Näitä johdannaisia voidaan käyttää sydänverisuonijärjestelmässä esiintyvien tiettyjen patologisten oireyhtymien käsittelyyn.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser förfaranden och mellanprodukter för framställning av nya indolizinderivat med den allmänna formeln



där

B betecknar en -S-, -SO- eller -SO₂-grupp,

R betecknar väte, en rak eller förgrenad alkyl, en cykloalkyl med högst 6 kolatomer, eller en fenylgrupp, som är osubstituerad eller substituerad med en eller flere likadana eller olika substituenten, som är valda bland halogenatomer, lägre alkylgrupper, lägre alkoxygrupper och nitrogrupper

R₁ och R₂, vilka är samma eller olika grupper, betecknar oberoende av varandra väte, en metyl eller etyl eller halogen,

A betecknar en rak eller förgrenad alkyl med 2...5 kolatomer eller en 2-hydroxipropylen,

R₃ betecknar en rak eller förgrenad alkyl eller en radikal med formeln Alk-R₅, där Alk betecknar en enkel bindning eller en rak eller förgrenad alkyl med 1...5 kolatomer, och R₅ betecknar en pyridyl, fenyl, 2,3-metylendioxyfenyl eller 3,4-metylendioxyfenyl eller en fenylgrupp, som är substituerad med en eller flere likadana eller olika substituenten, som är valda bland halogenatomer, lägre alkylgrupper eller lägre alkoxygrupper,

R₄ betecknar väte eller en alkyl, eller

R₃ och R₄ betecknar tillsammans en alkyl eller alkenyl med 3...6 kolatomer vilken valbart är substituerad med en fenyl, eller vilken valbart bryts av -O-, -NH-, -N= eller -N-R₆, där R₆ betecknar en lägre alkyl eller en fenyl,

samt även för framställning av farmaceutiskt acceptabla salter av dessa derivat.

Dessa derivat kan användas för behandling av vissa patologiska syndrom i det kardiovaskulära systemet.