

C 07 D 487

Ans.nr.: 0871/82

Indleveret: 26 feb 1982

Løbedag: 26 feb 1982

Alm. tilgængelig: 28 aug 1982

Prioritet: 27 feb 1981 CH 1340/81

F. *HOFFMANN-LA ROCHE & CO AKTIEN-
GESELLSCHAFT; Basel, CH.

Opfinder: Walter *Hunkeler; CH, Emilio *Ky-
burz; CH.

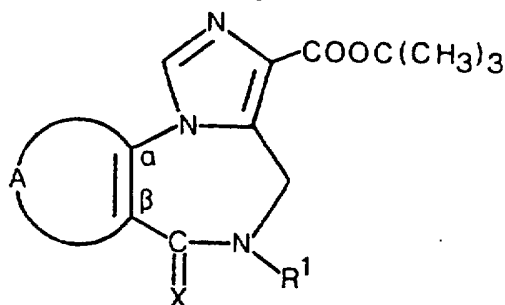
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou &
Co

Fremgangsmåde til fremstilling af imi-
dazodiazepiner eller farmaceutisk acceptable
syreadditionssalte deraf

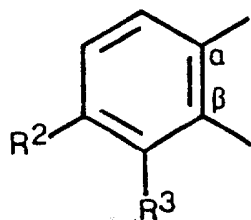
SAMMENDRAG.

871-82

Hidtil ukendte imidazodiazepiner med den almene formel

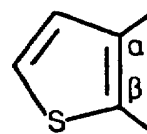


i hvilken A sammen med de to med α og β betegnede carbonatomer
betyder gruppen



(a)

eller



(b)

X betyder et oxygen- eller svovlatom, og R^1 betyder hydrogen eller lavere alkyl, og R^2 betyder hydrogen, trifluormethyl, halogen, cyano eller nitro, og R^3 betyder hydrogen, eller R^2 betyder hydrogen, og R^3 betyder trifluormethyl, halogen, cyano, nitro eller lavere alkyl, eller farmaceutisk acceptable syreadditionssalte deraf, fremstilles ved en række forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne I og deres syreadditionssalte er nyttige til antagonisering af de centralt dæmpende, muskelafslappende, ataktiske, blodtrykssænkende og åndedrætsdepressive egenskaber af tranquiliserende virksomme 1,4-benzodiazepiner, f.eks. som modgiftsstoffer ved intoksikationer med tranquiliserende virksomme 1,4-benzodiazepiner, og til afkortning af en ved hjælp af sådanne 1,4-benzodiazepiner indledt anæsthesi. Forbindelserne I kan også anvendes til undertrykkelse af virkningerne på centralnervesystemet af på andre indikationsområder anvendte 1,4-benzodiazepiner, f.eks. af schistosomicidt virksomme 1,4-benzodiazepin-derivater såsom (+)-5-(o-chlorophenyl)-1,3-dihydro-3-methyl-7-nitro-2H-1,4-benzodiazepin-2-on.

Forbindelserne I og deres salte kan som nævnt fremstilles efter forskellige metoder og bringes på galeniske indgivelsesformer.