

C 07 D 241

Ans.nr.: 2021/83

Indleveret: 05 maj 1983

Løbedag: 05 maj 1983

Alm. tilgængelig: 07 nov 1983

Prioritet: 06 maj 1982 US 375526

06 maj 1982 US 375507

\*AMERICAN CYANAMID COMPANY; Wayne,  
US.

Opfinder: Mila Ti \*Du; US, Robert Gordon  
\*Shepherd; US.

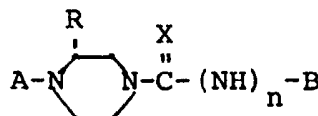
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou &  
Co

Fremgangsmåde til fremstilling af 1-pipera-  
zinderivater

S A M M E N D R A G

2021-83

1-Piperazinderivater med formlen



hvor X er oxygen eller svovl, og når X er oxygen, er A 2-pyrazinyl, 2-quinoxalinyll, 2-quinolyll, p-chlorphenyl, 3-pyridylmethyl, 2-thiazolyll eller 6-methoxy-2-pyrazinyl, B er phenyl, mono- eller polysubstitueret phenyl (hvor substituenterne kan være fluor, C<sub>1-4</sub>-alkyl eller trifluormethyl, benzyl, mono- eller disubstitueret benzyl (hvor substituenterne kan være chlor, nitro eller C<sub>1-3</sub>-alkyl), C<sub>1-7</sub>-alkyl, C<sub>3-6</sub>-cycloalkyl, pyridyl, 2-phenoxypropionyl, C<sub>1-4</sub>-alkylamino, polyfluor(F<sub>7-14</sub>)-C<sub>3-7</sub>-alkyl, mono- eller disubstitueret phenylamino (hvor substituenterne kan være chlor, carboxy eller carboethoxy), 6-p-chlorphenylhexyl, 5-(p-chlorbenzoyl)butyl, 2-p-chlorphenoxy-2-isopropyl eller 1-methylbenzyl, R er hydrogen eller C<sub>1-3</sub>-alkyl, og n er 0, og når X er svovl, er A pyrazinyl, quinolyll eller methoxypyrazinyl,

B er cycloalkyl, benzyl, phenethyl eller phenyl substitueret med mindst én substituent (hvor substituenten kan være carbo(C<sub>1-4</sub>)-alkoxy, carboxy eller cyano), R er hydrogen, og n er 1, fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne med formlen I kan anvendes til behandling af atherosclerose hos pattedyr ved inhibering af enzymet fedtacyl CoA:cholesterolacyltransferase til sænkning af serumlipid- og cholesterylesterniveauet i arterievæggene til forebyggelse og bedring af atherosclerotiske læsioner.