

C 07 D 233

Ans.nr.: 1318/85

Indleveret: 22 mar 1985

Løbedag: 22 mar 1985

Alm. tilgængelig: 24 sep 1985

Prioritet: 23 mar 1984 US 593012

\*PFIZER INC.; New York, US.

Opfinder: Christopher Andrew \*Lipinski; US.

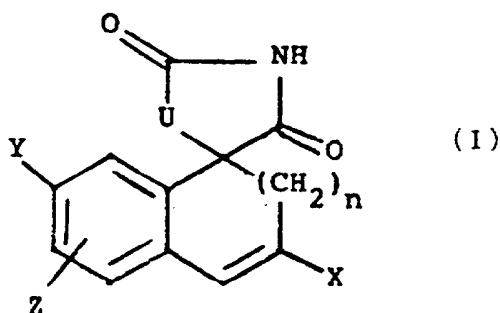
Fuldmægtig: Patentbureauet Hofman-Bang & Boutard

Spiro((imidazolidin, oxazolodin eller thiazolidin)-4,1'-(inden eller 1',2'-dihydronaphthalen))-2,5-dion-forbindelser og farmaceutiske præparat til behandling af diabetiske komplikationer

SAMMENDRAG:

1318-85

Spiro[(imidazolidin,oxazolidin eller thiazolidin)-4,1'-(inden eller 1',2'-dihydronaphthalen)]-2,5-dion-forbindelser med formlen:



hvori X=H eller alkyl; n = 0 eller 1; Y = H, Hal., nitro, CF<sub>3</sub>, OH, alkoxy eller alkylthio eller alkyl, og

Z er H, Halo, nitro,  $CF_3$ , OH alkoxy eller alkyl, forudsat at dersom Y eller Z er nitro, er den anden H, eller farmaceutisk acceptable salte deraf, fremstilles ved flere metoder, f.eks. ud fra en passende benzen- $\gamma$ -oxosyre, der kondenseres med et ammoniumsalt og et alkalimetalcyanid, hvorefter kondensationsproduktet omsættes med en stærk Lewis syre til 1-indanon-, hhv 1-tetralon-forbindelser, der videreomdannes til (I) med eventuelt påfølgende saltdannelse.

Forbindelserne er kraftigt virkende inhibitorer for enzymet aldose reductase, hvorfor de kan bruges til forebyggelse eller afhjælpning af diabetiske komplikationer forårsaget af uønsket akkumulering af galactitol og sorbitol i forskellige organer, såsom øjnene.