

C 07 D 491

Ans.nr.: 1449/84

Indleveret: 29 feb 1984

Løbedag: 29 feb 1984

Alm. tilgængelig: 26 sep 1984

Prioritet: 25 mar 1983 DE 3311003

\*BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; Leverkusen, DE.

Opfinder: Siegfried \*Goldmann; DE, Friedrich \*Bossert; DE, Matthias \*Schramm; DE, Guenter \*Thomas; DE, Rainer \*Gross; DE.

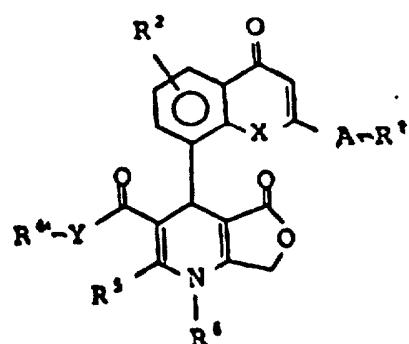
Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & C0

Substituerede 1,4-dihydropyridinlactoner, fremgangsmåder til deres fremstilling og deres anvendelse som lægemidler

SAMMENDRAG.

1449 - 84

Hidtil ukendte dihydropyridiner med den almene formel



i hvilken R<sup>1</sup> betyder hydrogen, en alifatisk carbonhydridgruppe, en carboxylsyrealkylester, en aromat eller heteroaromat, der eventuelt indeholder 1 til 5 ens eller forskellige substituenter fra gruppen halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, cyano, hydroxy, nitro, mono- eller polyfluoralkyl, mono- eller polyfluoralkoxy, mono- eller polyfluoralkylthio, amino, monoalkylamino og dialkylamino, R<sup>2</sup> betyder 1 til 3 halogenatomer eller hydrogen, og

$R^4$  betyder en mættet eller umættet carbonhydridgruppe, som eventuelt er substitueret med alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, trialkylsilyl, halogen, cyano, hydroxy, amino, alkylamino, dialkylamino, morpholinyl, piperidyl, piperazinyl, nitro, nitrat, aryl eller heteroaryl, idet aryl- eller heteroaryl-grupperne eventuelt kan være substituerede med 1 til 3 ens eller forskellige substituenter fra gruppen halogen, alkyl, alkoxy, alkylthio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, hydroxy, cyano, nitro, amino, alkylamino, dialkylamino, mono- eller polyfluoralkyl eller mono- eller polyfluoralkoxy,

$R^5$  betyder hydrogen eller en mættet eller umættet aliphatiske alkylgruppe, som eventuelt indeholder 1 eller 2 ens eller forskellige heterokædemedlemmer fra gruppen O, CO, NH, N-alkyl, S eller  $SO_2$ , og som eventuelt er substitueret med halogen, nitro, cyano, azido, hydroxy, aryl, heteroaryl, amino, monoalkylamino eller dialkylamino,

$R^6$  betyder hydrogen eller en alkylgruppe, som eventuelt er substitueret med alkoxy, halogen eller morpholino,

A betyder en enkeltbinding, en alkylenkæde eller en alkenylenkæde, som eventuelt kan være afbrudt med O eller S,

X betyder O eller S, og

Y betyder en enkeltbinding, O, S, -NH- eller N-alkyl, i form af isomere, isomerblandinger, racemater og optiske antipoder samt deres farmaceutisk tålelige salte, kan fremstilles ved en række forskellige fremgangsmåder.

De ovenfor nævnte dihydropyridiner kan anvendes som lægemidler til forbedring af hjertekontraktiliteten, til forhøjelse af blodtrykket, til sænkning af blodsukker, til behandling af hævede slimhinder og til påvirkning af salt- og/eller væskebalancen.