

Title (en)

N-Substituted 9,10-dihydrolysergic acid esters and a method for their preparation.

Title (de)

N-Substituierte 9,10-Dihydrolysergsäureester sowie ein Verfahren zu deren Herstellung.

Title (fr)

Des esters de l'acide 9,10-dihydrolysergique N-substitués et un procédé pour leur préparation.

Publication

EP 0000533 A1 19790207 (DE)

Application

EP 78100419 A 19780718

Priority

YU 181977 A 19770721

Abstract (en)

[origin: ES471716A1] A process for the preparation of N-substituted esters of 9,10-dihydrolysergic acids of the formula: < IMAGE > (I) wherein R1 is an alkyl group of 1-5 carbon atoms, an alkenyl group of 2-5 carbon atoms or a cycloalkyl group of 3-5 carbon atoms, R2 is hydrogen or an alkoxy group of 1-3 carbon atoms and X' is hydrogen or halogen, characterized in that esterified 9,10-dihydrolysergic acids of the formula: < IMAGE > (II) wherein R is hydrogen or a hydrolyzable organic group, X' is hydrogen or halogen, and R2 has the meaning as stated above, are reacted with a compound of the formula: R1Y (III) wherein R1 has the meaning as stated above, Y is halogen or sulphate, in the presence of a catalyst for phase transition in the presence of aqueous alkali medium in an inert organic solvent immiscible with water, and certain novel esters obtained thereby.

Abstract (de)

N-Substituierte 9,10-Dihydrolysergsäureester der Formel <IMAGE> worin R1 Alkylreste mit 1-5 C-Atomen, Alkenylreste mit 2-5 C-Atomen oder Cycloalkylreste mit 3-5 C-Atomen, R2 Wasserstoff oder Alkoxyreste mit 1-3 C-Atomen und X Wasserstoff oder Halogen bedeuten, wobei die Verbindung, worin R1 Methyl- oder Äthylreste und R2 und X Wasserstoff bedeuten, sowie die Verbindung worin R1 einen Methylrest, R2 einen Methoxyrest und X Wasserstoff bedeuten, ausgenommen sind, als Zwischenverbindungen für die Synthese von therapeutisch hochwirksamen Verbindungen sowie Verfahren zu ihrer Herstellung durch Umsetzung von gegebenenfalls veresterten 9,10-Dihydrolysergsäuren der allgemeinen Formel <IMAGE> worin R Wasserstoff oder einen in alkalischen Medium hydrolysierbaren organischen Rest bedeutet und X und R2 die vorstehend angegebenen Bedeutungen besitzen, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel R1Y (III) worin R1 die unter der Formel I angegebene Bedeutung hat und Y Halogen oder Sulfat bedeutet, in Anwesenheit eines Katalysators zur Phasenübertragung, eines mit Wasser nicht mischbaren inerten organischen Lösungsmittels und einer alkalischen wässrigen Phase. Diese Verfahren zeichnet sich gegenüber bekannten Verfahren durch eine gute Selektivität, einen einfachen und schnellen Reaktionsverlauf, wobei die Reaktion leicht kontrolliert werden kann, die Verwendung von üblichen Lösungsmitteln, aus denen das Wasser nicht entfernt werden braucht, sowie vorallem durch Reaktionsbedingungen aus, die ein gefahrloses Arbeiten ermöglichen. Die Verbindungen sind wichtige Zwischenverbindungen zur Synthese von therapeutisch hochwirksamen Verbindungen mit N-substituierter Gruppe in der 1-Stellung.

IPC 1-7

C07D 457/04

IPC 8 full level

C07D 457/02 (2006.01); **A61K 31/48** (2006.01); **B01J 31/00** (2006.01); **C07B 61/00** (2006.01); **C07D 457/04** (2006.01)

CPC (source: EP US)

C07D 457/04 (2013.01 - EP US)

Citation (search report)

FR 1175276 A 19590323 - SANDOZ AG

Cited by

EP0291270A3; EP0218433A1; EP0219256A1; EP0208622A1; FR2584720A1; US4754037A; EP0211728A1; FR2584721A1; US4739061A

Designated contracting state (EPC)

BE CH DE FR GB SE

DOCDB simple family (publication)

EP 0000533 A1 19790207; **EP 0000533 B1 19810805**; AT 363195 B 19810710; AT A490078 A 19801215; CS 216231 B2 19821029; DE 2860896 D1 19811105; ES 471716 A1 19791001; FI 64369 B 19830729; FI 64369 C 19831110; FI 782081 A 19790122; JP S5436296 A 19790316; JP S5648512 B2 19811116; PT 68278 A 19780801; SU 784775 A3 19801130; US 4230859 A 19801028; YU 181977 A 19830121; YU 40004 B 19850630

DOCDB simple family (application)

EP 78100419 A 19780718; AT 490078 A 19780706; CS 479078 A 19780718; DE 2860896 T 19780718; ES 471716 A 19780714; FI 782081 A 19780629; JP 8850978 A 19780721; PT 6827878 A 19780712; SU 2637592 A 19780720; US 92269278 A 19780707; YU 181977 A 19770721