



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 923751

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07D 221/10

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.08.92

(24) Alkuperä - Löpdag 20.08.92

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 22.02.93

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

21.08.91 US 748134 P

21.10.91 US 780166 P

(71) Hakija - Sökande

1. Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, Ind., USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Hirsch, Kenneth Steven, 6473 Haviland Mill Road, Clarksville, Md. 21029, USA, (US)

2. Jones, Charles David, 223 East Brunswick Avenue, Indianapolis, Ind. 46227, USA, (US)

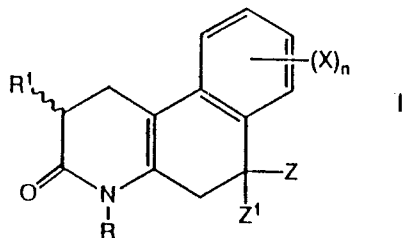
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Heksaahydrobentso/f/kinolinoneja
Hexahydrobenso/f/kinolinoner

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee kaavan I mukaisten
1,2,3,4,5,6-heksaahydrobentso[f]kinolino-
nien valmistusta,



jossa R on vety, alkyyli tai fenyylialkyyli; Z ja Z¹ ovat vetyjä tai alkyyylejä; R¹ on vety tai alkyyli; n on 1 tai 2; X on vety, halogeeni, NO₂, syano, CF₃, alkyyli, alkoksi, karboksi, alkoksikarbonyyli, amino, alkyyliamino, dialkyyliamino, amido, alkyyliamido, dialkyyliamido, merkapto, alkyyliitio, alkyyliisulfonyyli, alkyyliisulfonyyli tai ryhmä -A-R², jossa A on alkyleeni, alkenyleeni tai alkynyleeni; ja R² on halogeeni, hydroksi, CF₃, alkoksi, karboksi, alkoksikarbonyyli, amino, alkyyliamino, dialkyyliamino, amido, alkyyliamido, dialkyyliamido, alkyyliisulfonyyliamino, aminosulfonyyli tai alkyyliamino-sulfonyyli. Keksintö koskee myös yhdisteiden käyttöä steroidi-5α-reduktaasi-inhibiittoreina, mm. kaljuuden ja hirsutismin hoitoon.

Uppfinningen avser framställning av 1,2,3,4,5,6-hexahydrobenso[f]kinolin-3-oner med formeln I, vari R är väte, alkyl eller fenylalkyl; Z och Z¹ är väte eller alkyl; R¹ är väte eller alkyl; n är 1 eller 2; X är väte, halogen, NO₂, cyano, CF₃, alkyl, alkoxi, karboxi, alkoksikarbonyl, amino, alkylamino, dialkylamino, amido, alkylamido, dialkylamido, merkapto, alkyltio, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl eller gruppen -A-R², vari A är alkylen, alkenylen eller alkynylen; och R² är halogen, hydroxi, CF₃, alkoxi, karboxi, alkoksikarbonyl, amino, alkylamino, dialkylamino, amido, alkylamido, dialkylamido, alkylsulfonylamino, aminosulfonyl eller alkylaminosulfonyl. Uppfinningen avser även användning av föreningarna som steroid-5α-reduktaasinhibitorer bland annat för behandling av skallighet och hirsutism.