



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 914262

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

C 07D 403/06
// (C 07D 403/06, 209:14, 239:91)

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 10.09.91

(24) Alkuperä - Löpdrag 10.09.91

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 14.03.92

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

13.09.90 US 581943 P

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. McCowan, Jefferson Ray, 2653 Crescent Hill Lane, Indianapolis, Ind. 46208, USA, (US)
2. Thrasher, Kenneth Jeff, 4442A Willow Bend Drive, Beech Grove, Ind. 46107, USA, (US)
3. Yu, Melvin Joseph, 1252 West 81st Street, Indianapolis, Ind. 46260, USA, (US)

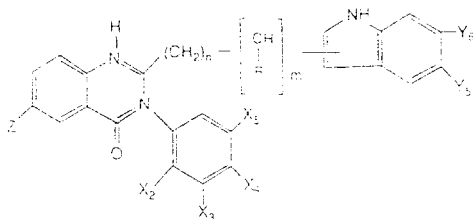
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

3-aryyli-4(3H)kinatsolinoni-CCK-antagonisteja ja niiden farmaseuttisia formulaatioita
3-aryl-4(3H)kinazolinon CCK-antagonister och farmaceutiska kompositioner därav

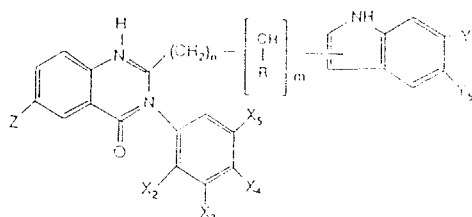
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee menetelmää substituutujen kinatsolinonien valmistamiseksi, joilla on kaava



jossa n on 1 tai 2 ja m on 0 tai 1; R on vety, C₁-C₄-alkyyli, bentsyyli tai fenyyli; Z on vety tai halogeeni; X₂, X₃, X₄ ja X₅ ovat vety, halogeeni, trifluorimetyyli, C₁-C₆-alkoksi, C₁-C₆-alkyyli, C₁-C₆-alkyyli-tio, tai -NR₂R₃, jossa R₂ ja R₃ ovat vety, C₁-C₄-alkyyli, bentsyyli tai fenyyli, tai R₂ ja R₃ muodostavat 5- tai 6-jäsenisen renkaan yhdessä typpi-atomin kanssa, johon ne ovat kiinnittyneet; tai X_r ja X_{r+1}, jossa r on 2, 3 tai 4, muodostavat yhdessä C₃-C₅-alkyleeni- tai metyleenidioksiryhmän; ja Y₅ ja Y₆ ovat vety, C₁-C₆-alkyyli, C₁-C₆-alkoksi, halogeeni tai trifluorimetyyli. Kinatsolinonit ovat CCK-reseptoriantagonisteja, ja niillä on käyttöä ruoansulatuskanavan ja keskushermoston häiriöiden hoidossa.

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av substituerade kinazolinoner med formeln



vari n är 1 eller 2 och m är 0 eller 1; R är väte, C₁-C₄-alkyl, bensyl eller fenyl; Z är väte eller halogen; X₂, X₃, X₄ och X₅ är väte, halogen, trifluormetyl, C₁-C₆-alkoxi, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkyltio eller -NR₂R₃, vari R₂ och R₃ är väte, C₁-C₄-alkyl, bensyl eller fenyl, eller R₂ och R₃ bildar en 5- eller 6-komponentig ring tillsammans med kväveatomen, till vilken de är bundna; eller X_r och X_{r+1}, vari r är 2, 3 eller 4, bildar tillsammans en C₃-C₅-alkylen- eller metylendioxigrupp; och Y₅ och Y₆ är väte, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxi, halogen eller trifluormetyl. Kinazolinerna är CCK-reseptorantagonister och de är användbara vid behandling av störningar i matsmältningskanalen och i det centrala nervsystemet.