



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 943119

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

C 07D 213/74, 213/85, 213/89, 231/38, 215/46,
333/44, 241/20, 221/04

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 29.06.94

(24) Alkupäivä - Löpdag 22.12.92

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 29.06.94

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP92/02993

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

30.12.91 EP 91203431 P

(71) Hakija - Sökande

1. Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium, (BE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Janssen, Marcel August Constant, Karel Druytslaan 15, 2350 Vosselaar 1, Belgium, (BE)
2. Van Daele, Georges Henri Paul, Kongostraat 156, 2300 Turnhout, Belgium, (BE)
3. Bosmans, Jean-Paul Rene Marie Andre, Sleekestraat 21, 8510 Kortrijk-Marke, Belgium, (BE)
4. Verdonck, Marc Gustaaf Celine, Lozijde 71, 2275 Gierle, Belgium, (BE)
5. Janssen, Paul Adriaan Jan, Antwerpsesteenweg 20, 2350 Vosselaar, Belgium, (BE)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

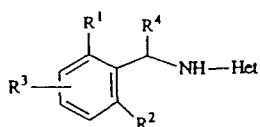
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Heterosyklisellä renkaalla substituoituja bentsyyliamiinijohdannaisia retrovirusvastaisina yhdisteinä
Heterocykliskt substituerade bensylaminderivat som antiretrovirala föreningar

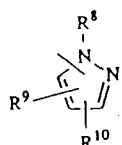
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Esillä oleva keksintö koskee retrovirusvastaisia (esim. HIV-1) yhdisteitä, joiden kaava on (I), jossa R^1 ja R^2 ovat kumpikin toisistaan riippumatta halogeeni tai metyyli; R^3 on halogeeni, nitro tai trifluorimetyyli; R^4 on trifluorimetyyli tai metyylikarbonyyli; tai radikaali $-C(=X)-NR^5R^6$, jossa X on O tai S ja R^5 ja R^6 ovat toisistaan riippumatta vety tai C_{1-4} -alkyyli; tai radikaali $-Alk-R^7$, jossa Alk on C_{1-4} -alkaanidiyli ja R^7 on vety tai hydroksi; Het on heterosyklinen radikaali, jonka kaava on (a), (b), (c), (d) tai (e). Farmaseuttisia koostumuksia, jotka sisältävät mainittuja kaavan (I) mukaisia yhdisteitä, sekä menetelmiä mainittujen yhdisteiden ja koostumusten valmistamiseksi.

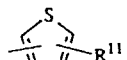
Uppfinningen avser antiretrovirala (exempelvis anti-HIV-1) föreningar med formeln (I), vari R^1 och R^2 envar självständigt är halogen eller metyl; R^3 är väte, halogen, nitro eller trifluormetyl; R^4 är trifluormetyl eller metylkarbonyl; eller radikal $-C(=X)-NR^5R^6$, vari X är O eller S, och R^5 och R^6 är envar självständigt väte eller C_{1-4} -alkyl; eller en radikal $-Alk-R^7$, vari Alk är C_{1-4} -alkandiyl och R^7 är väte eller hydroxi; Het är en heterocyklisk radikal med formlerna (a); (b); (c); (d) eller (e). Uppfinningen avser även farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller nämnda föreningar med formeln (I) och förfaranden för framställning av nämnda föreningar och kompositioner.



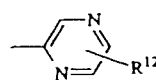
(I)



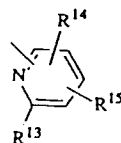
(a)



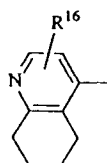
(b)



(c)



(d)



(e)