



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	931413
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07D 401/06, C 07D 401/12	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	29.03.93
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	29.03.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	01.10.93
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
30.03.92 FR 9203828 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Synthelabo, 22, Avenue Galilee, 92350 Le Plessis-Robinson, France, (FR)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Lassalle, Gilbert, 53 avenue Victor Hugo, 92140 Clamart, France, (FR)
2. Purcell, Thomas, 47 bis rue de la Milliere, Les Mesnuls, 78490 Montfort l'Amaury, France, (FR)
3. Galtier, Daniel, 20 rue Jean Forest, 78210 Saint Cyr l'Ecole, France, (FR)
4. Williams, Paul Howard, 24 rue Saint Bernard, 75011 Paris, France, (FR)
5. Galli, Frederic, 3 Residence de l'Orangerie, 78170 La Celle Saint Cloud, France, (FR)

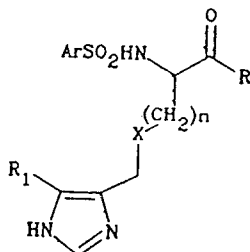
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

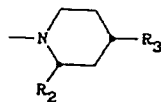
1-(2-(aryylisulfonyyliamino)-1-oksoetyyli)piperidiini johdannaisia, niiden valmistus ja niiden käyttö terapiassa
1-(2-(aryylisulfonyyliamino)-1-oksoetyyli)piperidinderivat, framställning av dessa och användning av dessa i terapi

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee 1-[2-(aryylisulfonyyliamino)-1-oksoetyyli]piperidiini johdannaisia (I),



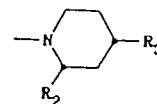
jossa R on ryhmä



R₂ on vety, alkoksikarbonyyli, karboksyyli, natriumkarboksylaatti, -CH₂OR₄, jossa R₄ on vety, alkyylili tai asyyli, -CONR₅R₆, tai -CN₄R₅, joissa R₅ on vety tai alkyylili ja R₆ on vety, alkyylili, hydroksi, alkoksi tai alkoksifenyyli ja R₃ on alkyylili, C₁₋₄-alkyyli, R₁ on vety tai alkyylili, X on rikki, happi tai metyleeni, n = 1 tai 2, ja Ar on naftalen-1-yyli, joka on substituoitu di-C₁₋₄-alkyyliaminolla, tai 6,7-di-C₁₋₄-alkoksinaftalen-1-yyli tai kinolein-8-yyli, joka on substituoitu alkyylillä tai 1,2,3,4-tetrahydrokinolein-8-yyli, joka on

substituoitu alkyyliryhmällä, tai 1H-indatsol-7-yyli, ja niiden additiosuoloja. Näillä yhdisteillä on käyttöjä terapiassa. Keksintö koskee myös yhdisteiden (I) valmistusta ja niitä sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia.

Uppfinningens avser 1-[2-(aryylisulfonyyliamino)-1-oksoetyyli]piperidinderivat (I), vari R är en grupp



R₂ är väte, alkoksikarbonyl, karboxyl, natriumkarboxilat, -CH₂OR₄ är väte, alkyl eller acyl, -CONR₅R₆ eller -CN₄R₅, vari R₅ är väte eller alkyl och R₆ är väte, alkyl, hydroxi, alkoxi eller alkoxifenyl och R₃ är alkyl, C₁₋₄-alkyl, R₁ är väte eller alkyl, X är svavel, syre eller metylen, n = 1 eller 2 och Ar är naftalen-1-yl, substituerad med di-C₁₋₄-alkylamino, eller 6,7-di-C₁₋₄-alkoxinaftalen-1-yl eller kinolein-8-yl, substituerad med alkyl, eller 1,2,3,4-tetrahydrokinolein-8-yl, substituerad med en alkylgrupp, eller 1H-indazol-7-yl, och deras additionssalter. Dessa föreningar finner användning inom terapin. Uppfinningen avser även framställningen av föreningarna (I) och farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller dem.