



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus—Patentansökan 885271

(51) Kv. lk.⁴/Int. cl.⁴ C 07 C 131/00,
C 07 D 285/10, 215/12

(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 15.11.88

(23) Alkuperäpäivä—Löpdag

(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 15.11.88

(86) Kv. hakemus—Int. ansökan US88/00386

(30) Etuoikeus—Prioritet 16.03.87 US 026002

(71) Hakija/Sökande: *University of Florida*, 207 Tigert Hall, Gainesville, Florida, USA

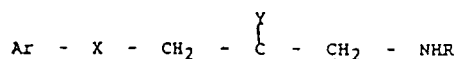
(72) Keksijä/Uppfinnare: Bodor, Nicholas

(74) Asiamies/Ombud: Leitzinger

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: 3-substituoitu-1-alkyyliamino-2-propanolien labiilit ketonijohdokset ja niiden käyttö β -adrenergiinisina salpausaineina. Labila ketonderivat av 3-substituerad-1-alkylamino-2-propanoler och deras användning som β -adrenerginiska blockeringsämne.

(57) Tiivistelmä

β -adrenergiinisiä salpaavia ominaisuuksia omaava yhdiste, jolla on kaava



jossa

X on -O-, -CH₂- tai —;

Y on =O, tai derivatisoitu ketoryhmä,

joista kukin voidaan hydrolysoida

tai muuntaa entsyymaattisesti ketoniryhmäksi;

R on 1-12-hiiliatominen alkyyli tai

7-20-hiiliatominen aralkyyli; ja

Ar on 1-alkyyliamino-2-propanolin,

jossa on 3-asemassa syklinen substituentti,

3-ryhmä, jolla substituoidulla propanolilla on β -adrenergiinisiä salpaavia

ominaisuuksia; tai

sen happoadditiosuola farmaseuttisesti

hyväksyttävän hapon kanssa.

Keksinnön kohteena ovat myös farmaseuttiset

seokset, jotka sisältävät edellä

mainittuja yhdisteitä sekä hoitomenetelmät.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser en förening med

β -adrenergeniska blockeringsgenskaper,

vilken förening har formeln I, där

X är -O-, -CH₂- eller —;

Y är =O eller en derivatiserad keto-

grupp, av vilka envar kan hydrolyseras

eller enzymatiskt omvandlas till en

ketonisk grupp;

R är 1-12-kolatoms alkyl eller 7-20-

kolatoms aralkyl; och

Ar är den 3-aromatiska eller -hetero-

cykliska resten av en 1-alkylamino-2-

propanol, vilken substituerade propanol

har β -adrenergeniska blockerings-

genskaper; eller

ett syraadditionssalt därav med en

farmaceutiskt godtagbar syra.

Uppfinningen avser även farmaceutiska

kompositioner, som innehåller ovannämnda

föreningar samt behandlingsförfaranden.