



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 956086

(51) Kv.1k.6 - Int.cl.6

C 07C 403/20, 403/08, 57/48, 33/38
C 07D 333/24, 277/34, 307/87

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 18.12.95

(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 18.12.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 20.06.96

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

19.12.94 US 359141 P

14.11.95 US 542146 P

(71) Hakija - Sökande

1. American Cyanamid Company, Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940-0874, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Quing, Feng-Ling, Apartment 2-501, 362 Fenglin Lu, Shanghai 200032, China, (CN)
2. Birnberg, Gary Harold, Box 671 Benjamin Meadow Road, Monroe, NY 10950, USA, (US)
3. Epstein, Joseph William, 19 Briarwood avenue, Monroe, NY 10950, USA, (US)
4. Gilbert, Adam Matthew, 770 Sierra Vista Lane, Valley Cottage, NY 10989, USA, (US)

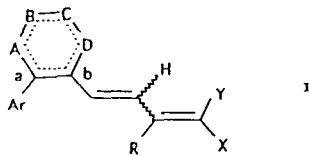
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

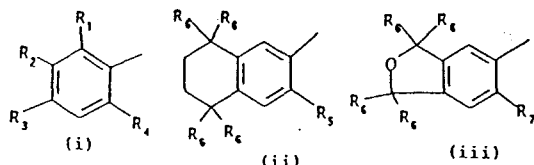
Rajoitettuja 9-cis-retinoideja
Begränsade 9-cis-retinoider

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö käsittää 9-cis-retinoiinihapon uudet analogit, jotka ovat käyttökelpoisia sepelvaltimotaudin hoitamiseksi ja estämiseksi ja suojan tuottamiseksi ennenaikaista ateroskleroosia vastaan lisäten HDL-pitoisuutta, menetelmät uusien 9-cis-retinoiinihappoanalogien valmistamiseksi sekä niitä sisältävät farmaseuttiset valmisteet. Uusilla yhdisteillä on kaava I



jossa A, B ja C ovat CH, CH₂, O tai S; D on (CH)_m, jossa m on 0 tai 1, tai (CH₂)_n, jossa n on 0, 1 tai 2; katkoviiva, ----, esittää mahdollista sidosta; R on vety, metyyli, etyyli, t-butyyl tai trifluorimetyyli; Ar on osuus, jolla on kaava (i), (ii) tai (iii)



X on vety ja Y on CH₂OH, CHO, CO₂H, CN, CH₂CONH₂, CO₂R₉ tai CONHR₉ tai X ja Y yhdessä muodostavat tiatsolidiinidionirenkaan; jolloin symboleilla R₁ - R₉ on patenttiväätimöksissä ilmoitetut merkitykset.

Uppfinningen omfattar nya analoger av 9-cis-retinsyra, vilka är användbara vid behandling och profylax av kranskärlssjukdomar och vid skapandet av skydd mot framtida ateroskleros genom ökning av HDL-halten, förfaranden för framställning av nya analoger av 9-cis-retinsyra samt dessa innehållande farmaceutiska preparat. De nya föreningarna har formeln I, vari A, B och C är CH, CH₂, O eller S; D är (CH)_m, vari m är 0 eller 1, eller (CH₂)_n, vari n är 0, 1 eller 2; den streckade linjen, ----, betecknar en eventuell bindning; R är väte, metyl, etyl, t-butyl eller trifluormetyl; Ar är en del med formeln (i), (ii) eller (iii), X är väte och Y är CH₂OH, CHO, CO₂H, CN, CH₂CONH₂, CO₂R₉ eller CONHR₉, eller X och Y bildar tillsammans en tiatsolidindionring; varvid symbolerna R₁ - R₉ har de i patentkrav 1 angivna betydelserna.