



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 933398

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

C 07D 263/32, 263/48, 233/61, 235/14
277/28, 413/06, 487/08

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 29.07.93

(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 29.07.93

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 01.02.94

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

31.07.92 US 923399 P

15.04.93 US 048338 P

(71) Hakija - Sökande

1. Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue, New York, N.Y. 10154, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Balasubramanian, Neelakantan, 41 Miller Road, Unit 16, Bristol, Conn., USA, (US)

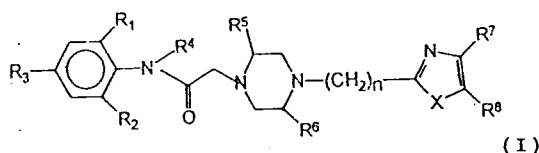
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

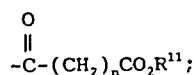
Adenosiinin takaisinottoa inhiboivat difenyylioksatsoli-, tiatsoli-
jaimidatsolijohdannaiset
Difenylloxazol-, tiazol- och imidazolderivat, vilka hämmar återupptagning av adenosin

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

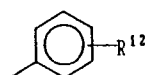
Keksintö koskee 4,5-difenyyli-oksatsolien, tiatsolien ja imidatsolien 1-piperatsinyyli-N-fenyyliasetamidijohdannaisten (I) valmistusta, jotka ovat uusia adenosiinin kuljetuksen inhibiittoreita,



jossa R¹ ja R² ovat vety, alkyyli, alkoksi, halogeeni tai trifluorimetyyli; R³ on vety, halogeeni, alkoksi, nitro tai -NR⁹-R¹⁰, jossa R⁹ ja R¹⁰ ovat vety tai alkyyli, alkanoyyli tai

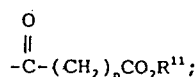


R⁴ on vety tai alkyyli; R⁵ ja R⁶ ovat vety, -CO₂R¹¹, jossa R¹¹ on alkyyli, -CONR⁹R¹⁰ tai okso, tai R⁵ ja R⁶ yhdessä muodostavat metyleeni- tai etyleenisillan; R⁷ ja R⁸ muodostavat yhdessä butyleenisillan tai kumpikin niistä on

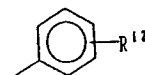


jossa R¹² on vety, trifluorimetyyli, halogeeni, alkyyli tai alkyyli-N(R⁴)₂; n on nolla tai 1 - 4; ja X on S, O tai NH.

Uppfinningen avser framställningen av 1-piperazinyl-N-fenylacetamidderivat (I) av 4,5-difenyl-oxazoler, tiazol- och imidazol-er, vilka är nya adenosintransportinhibitorer, vari R¹ och R² är väte, alkyl, alkoxi, halogen eller trifluormetyl; R³ är väte, halogen, alkoxi, nitro eller -NR⁹-R¹⁰, vari R⁹ och R¹⁰ är väte eller alkyl, alkanoyl eller



R⁴ är väte eller alkyl; R⁵ och R⁶ är väte, CO₂R¹¹, vari R¹¹ är alkyl, -CONR⁹R¹⁰ eller oxo, eller R⁵ och R⁶ bildar tillsammans en metylen- eller etylenbrygga; R⁷ och R⁸ bildar tillsammans en butylenbrygga eller vardera är



vari R¹², är väte, trifluormetyl, halogen, alkyl eller alkyl-N(R⁴)₂; n är noll eller 1 - 4; och X är S, O eller NH.

