

(19) DANMARK



(12) PATENTANSØGNING⁽¹⁰⁾ DK 2967/90 A

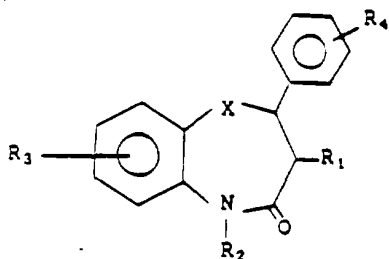
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 2967/90 (51) Int. Cl. 5: C 07 D 403/06
(22) Indleveringsdag:.... 13 dec 1990 C 07 D 223/14
(24) Løbedag:..... 23 maj 1989 C 07 D 401/06
(41) Alm. tilgængelig:.... 13 dec 1990 C 07 D 417/06
(62) Stamansøgningsnummer:.....
(86) International ansøgning nr.:... PCT/US89/02270
(86) International indleveringsdag: 23 maj 1989
(85) Videreførselsdag: 13 dec 1990
(30) Prioritet: 22 maj 1989 US 353806
(71) Ansøger: *E. R. Squibb & Sons, Inc., P.O. Box 4000; Lawrenceville-Prince
ton Road; New Jersey 08543-4000, US
(72) Opfinder: David M. *Floyd, R.R. 1, Box 404M; Pennington; New Jersey
08534, US
John T. *Hunt, 7 Skyfield Drive; Princeton; New Jersey 08540,
US
Spencer D. *Kimball, 13 Charred Oak Lane; East Windsor; New
Jersey 08540, US
John *Krapcho, 150 DeMott Lane; Somerset; New Jersey 08873, US
Jagabandhu *Das, 47 Joni Avenue; Hamilton Square; New Jersey
08690, US
George C. *Rovnyak, 10 W. Broad Street; Hopewell; New Jersey
08525, US
Joel C. *Barrish, 2157 Bromley Common; Holland; Pennsylvania
18966, US
(74) Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co., H.C. Andersens Boulevard 4
, 1553, København V

- (54) Benzazepin- og benzothiazepinderivater
(57) Sammendrag

2967-90

Hidtil ukendte benzazepin- og benzothiazepinderivater
med formlen



2967-90

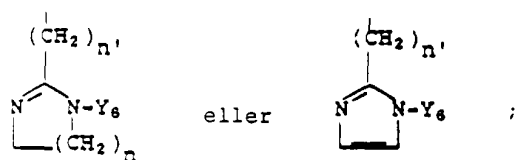
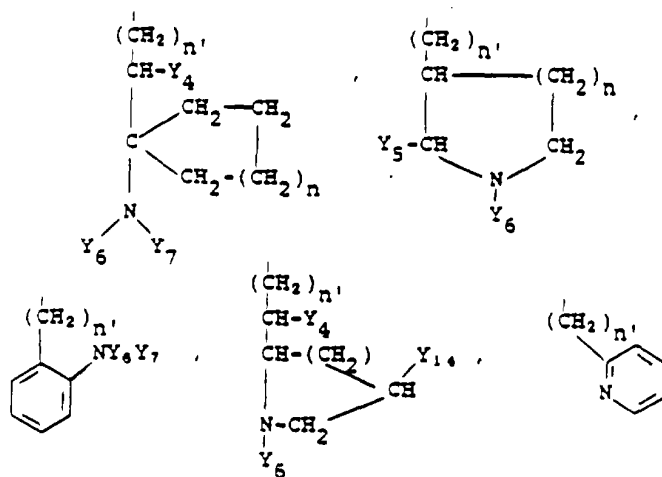
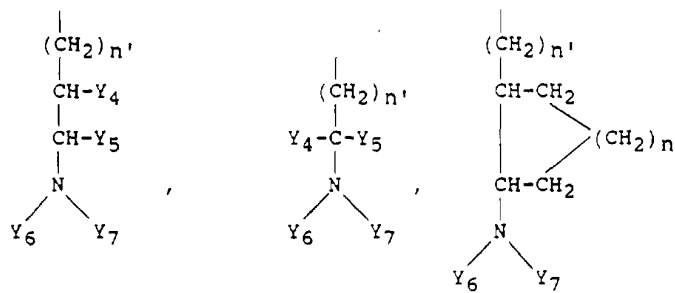
og de farmaceutisk acceptable salte deraf, hvor

X betyder -CH₂- eller -S-;

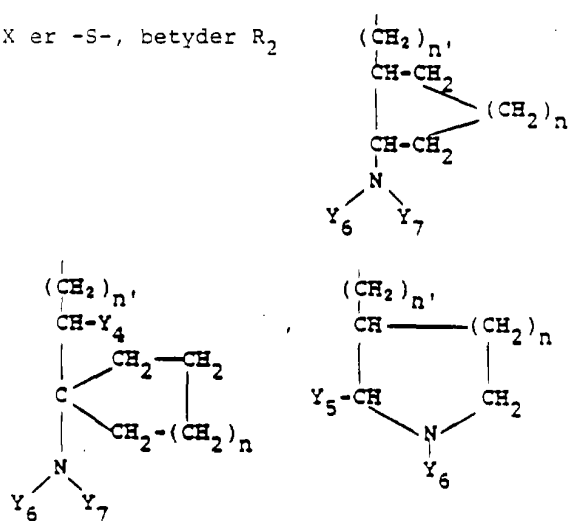
R₁ betyder $\begin{array}{c} Y_1 \\ | \\ -CH \\ | \\ Y_2 \end{array}$ eller -O-Y₃;

fortsættes

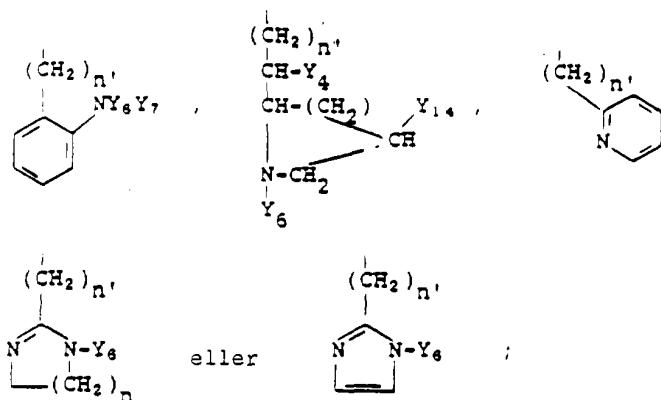
når X betyder $-\text{CH}_2-$, betyder R_2



når X er $-\text{S}-$, betyder R_2



2967-90



R_3 og R_4 uafhængigt af hinanden betyder hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy, aryloxy, arylalkoxy, arylalkyl, cyano,

hydroxy, alkanoyloxy, $-O-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-NY_8Y_9$, fluor-substitueret alkoxy, fluor-substitueret alkyl, (cycloalkyl)alkoxy,

$-NO_2$, $-NY_{10}Y_{11}$, $-S(O)_m$ alkyl, $-S(O)_m$ aryl, $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-Y_{12}$ eller

$-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-Y_{13}$;

2967-90

n eller n' uafhængigt af hinanden betyder 0, 1, 2 eller 3;
 m betyder 0, 1 eller 2;

Y_1 og Y_2 uafhængigt af hinanden betyder hydrogen eller alkyl,
 Y_1 betyder hydrogen, og Y_2 betyder alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl eller cycloalkyl, eller Y_1 og Y_2 sammen med det carbonatom, hvortil de er knyttet, betyder cycloalkyl;

Y_3 betyder hydrogen, alkyl, alkanoyl, alkenyl, arylcarbonyl,

heteroarylcarbonyl eller $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-NY_8Y_9$;

Y_4 og Y_5 uafhængigt af hinanden betyder hydrogen, alkyl, aryl eller arylalkyl, forudsat at når begge to er til

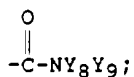
2967-90

stede, betyder de ikke begge hydrogen, og yderligere forudsat, at når begge to er knyttet til det samme carbonatom, betyder ingen af dem hydrogen;

Y₆ og Y₇ uafhængigt af hinanden betyder hydrogen, alkyl, cycloalkyl eller arylalkyl, eller Y₆ og Y₇ sammen med det nitrogenatom, hvortil de er knyttet, betyder azetidiny, pyrrolidinyl, piperidinyl eller morpholinyl;

Y₈ og Y₉ uafhængigt af hinanden betyder hydrogen, alkyl, aryl eller heteroaryl, eller Y₈ og Y₉ sammen med det nitrogenatom, hvortil de er knyttet, betyder pyrrolidinyl, piperidinyl eller morpholinyl;

Y₁₀ og Y₁₁ uafhængigt af hinanden betyder hydrogen, alkyl, alkanoyl, arylcarbonyl, heteroarylcarbonyl eller



Y₁₂ betyder hydroxy, alkoxy, aryloxy, amino, alkylamino eller dialkylamino;

Y₁₃ betyder alkyl, alkoxy eller aryloxy, og

Y₁₄ betyder hydrogen, hydroxy, alkoxy, aryloxy eller arylalkoxy,

har vasodilaterende aktivitet og kan derfor anvendes i lægemidler.