



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 944678
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07D 311/66
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 06.10.94
(24) Alkuperä - Löpdag 12.03.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 06.10.94
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/US93/02311
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
07.04.92 EP 92400972 P

(71) Hakija - Sökande

1. Merrell Dow Pharmaceuticals Inc., 2110 East Galbraith Road, Cincinnati, Ohio 45215, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Grisar, J. Martin, 7 rue de Mulhouse, 67160 Wissembourg, France, (FR)
2. Petty, Margaret A., 2 Allée de la Robertsau, 67000 Strasbourg, France, (FR)
3. Bolkenius, Frank, Bierkellerstrasse 15B, 7640 Kehl, BRD, (DE)

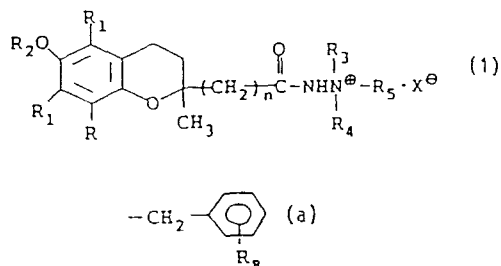
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

3,4-dihydro-2H-1-bentsopyraanien hydratsidijohdannaisia
Hydrazidderivat av 3,4-dihydro-2H-1-bensopyraner

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämä keksintö koskee uusia tiettyjen 3,4-dihydro-2H-1-bentsopyraanien hydratsidiasyylhydratsiniumjohdannaisia, joilla on kaava (I),



niiden stereoisomeerejä ja seoksia, niiden sisäisiä suoloja, ja niiden farmasettisesti hyväksyttäviä suoloja, joissa R on vety tai C₁₋₆-alkyyli, R₁ on C₁₋₆-alkyyli, R₂ on vety tai -C(O)R, R₃ ja R₄ merkitsevät toisistaan riippumatta C₁₋₆-alkyyliä; R₅ on C₁₋₆-alkyyli, tai (a) R₆:n ollessa vety tai halogeeni, n on nolla, 1, 2 tai 3, ja X on halogenidi, -S(O)₂R₆, tai ei mikään, kun sisäinen suola muodostuu, R₆ on vety, C₁₋₆-alkyyli, fenyyli tai 4-metyylifenyyli; välituotteita, menetelmiä ja tekniikoita niiden valmistamiseksi, niiden kykyä osoittaa ominaisuus, että ne ovat vapaan radikaalin sitoja, ja niiden loppukäyttösovellusta sairaustilojen hoidossa, joita voidaan parantaa vapaan radikaalin sitoilla.

Denna uppfinning avser nya hydrazidacylhydraziniumderivat av vissa 3,4-dihydro-2H-1-bensopyraner med formeln (I), deras stereoisomerer och blandningar, deras interna salt samt deras farmaceutiskt godtagbara salt, varvid R är väte eller C₁₋₆-alkyl, R₁ är C₁₋₆-alkyl, R₂ är väte eller -C(O)R, R₃ och R₄ är självständigt C₁₋₆-alkyl, R₅ är C₁₋₆-alkyl, eller (a) när R₆ är väte eller halogen, är n noll, 1, 2 eller 3, och X är en halogenid, -S(O)₂R₆, eller saknas, då det interna saltet bildas, R₆ är väte, C₁₋₆-alkyl, fenyl eller 4-metylfenyl; mellanprodukter, förfaranden och teknik för deras framställning, deras förmåga att manifesteras sin förmåga att renande utfälla fria radikaler och deras slutliga användning vid behandlingen av sjukdomstillstånd som kan förbättras genom renande utfällning av fria radikaler.