PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG
(11)(21) Patenttihakemus—Patentansökan 884471
(51) Kv.lk. 4/Int.Cl. 4 C 07 D 211/90, 403/12, 417/12,
249/10, 471/04, 487/04, 513/04
(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 29.09.88
(23) Alkupäivä—Löpdag
(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 31.03.89
(86) Kv. hakemus—Int. ansökan
(30) Etuoikeus—Prioritet 30.09.87 GB 8722977
25.02.88 GB 8804441

(71) Hakija/Sökande: Pfizer Limited, Ramsgate Road, Sandwich, Kent,
Isö-Britannia

Richardson, Kenneth 4. Steele, John

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Uusien terapeuttisesti
käyttökelpoisten dihydropyridinien valmistus. Framställning av nya
terapeutiskt användbara dihydropyridiner.

(57) Tiivistelmä
Keksinta koskee uusien kaavan I mukaisten 4-aryylli-5-karbanoyylli-
1,4-dihydropyridinienjohdannaisen ja niiden farmaceutisesti hy-
vääsyttävien suojelujen valmistusta,

![Chemical structure]

jossa kaavassa R on fenyyli, joka voi olla mono- tai polysubsti-
tuotu nitrolla, halogeeniailla, alkyljätillä, alkoksilla, arlylli-
alkoksilla, fluoralkoksilla, alkyllytiloilla, alkyllysufonyyllillä,
hydroksilla, trifluorimethylillä tai sanalla, tai R on di-
koksilirenkaaseen fuusioitunut fenyyli, R\textsuperscript{1} ja R\textsuperscript{2} tarkoittavat
toisistaan riippumatta vetyä tai C\textsubscript{1}-C\textsubscript{6}-alkyylia, tai R\textsuperscript{1} ja R\textsuperscript{2}
muodostavat yhdessä typpiatiomin kannsa, johon ne ovat liittynet
pyrroldinyylit-, piperdinynt-, morfofinno-, piperatsinyyli-
N-alkyly-piperatsinyyli- tai N-alkanoyylli-piperatsinyylyliryhmän,
tai R\textsuperscript{2} on vety tai C\textsubscript{1}-C\textsubscript{4}-alkyylia ja R\textsuperscript{1} on syano, sykloalkylyli,
arylly, heteroarylly tai substituoitu C\textsubscript{1}-C\textsubscript{4}-alkyylia, Z on alkoxi
tai arylalkoksia, Y on 1,4-fensyleeni tai pyridiini-2,5-diylly
ja X on 5- tai 6-jäseninen aromaatitinen, mahdollisesti substituoisi-
tu heterosyklilen rengas, jossa on yksi tai useampi tyyppiatiomi
ja mahdollisesti happi- tai rikkiatiomi, ja joka voi olla fuusioi-
tunut bentseenirenkaaseen tai toiseen 5- tai 6-jäseniseen hete-
rosykliseen renkaaseen. Näitä yhdisteet ovat käyttökelpoisia all-
lergisten ja inflamatoristen tilojen hoidossa.

Jatkuu seur. sivulla
Forts. nästa sida

* // (C 07 D 471/04, 221:00, 235:00), (C 07 D 487/04, 235:00, 239:00),
(C 07 D 513/04, 235:00, 277:00)
Sammandrag
Upptäckningen avser framställning av nya 4-aryl-5-mercaptol-1,4-dihydropyridinderivat med formeln I och farmaceutiskt godtagbara salter därav,

![Chemical structure](image)

i vilken formel R är fenyl, som kan vara mono- eller polysubstituerad med nitro, halogen, alkyl, alkoxi, arylaalkoxi, fluoralkoxi, alkyltio, alkylsulfonyle, hydroxi, trifluormethyl eller cyano, eller R är fenyl, som är fusionerad till en dioxolring, R¹ och R² betecknar beroende av varandra väte eller C₁-₆-alkyl, eller R¹ och R² bildar tillsammans med kväveatom en, till vilken de är bundna, en pyrrolidinyl-, piperidino-, morfolino-, piperazinyl-, N-alkyl-piperazinyl-, N-alkoxy-piperazinygrupp, eller R² är väte eller C₁-₄-alkyl och R¹ är cyano, cykloalkyl, arol, heteroaryl eller substituerad C₁-₄-alkyl, Z är alkoxi eller arylaalkoxi, Y är 1,4-fenyleen eller pyridin-2,5-diy och X är en 5- eller 6-ledad aromatisk, eventuellt substituerad heterocyklisk ring med en eller flera kväveatomer och eventuellt en syre- eller svavelatom, vilken ring kan vara fusionerad till en bensenring eller en annan 5- eller 6-ledad heterocyklisk ring. Dessa föreningar är användbara vid behandling av allergiska och inflammatoriska tillstånd.