



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 962155

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

C 07D 471/04 // A 61K 31/505

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 22.05.96

(24) Alkuperä - Löpdatum 16.11.94

(41) Tulnut julkiseksi - Blivit offentlig 22.05.96

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP94/03804

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

23.11.93 EP 93203270 P

(71) Hakija - Sökande

1. Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium, (BE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Vandenberk, Jan, Kempenlaan 15, 2340 Beerse, Belgium, (BE)

2. Kennis, Ludo Edmond Josephine, Guido Gezellestraat 50, 2300 Turnhout, Belgium, (BE)

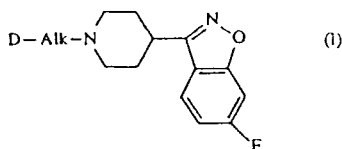
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

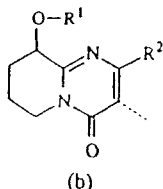
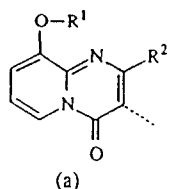
Uudet 9-hydroksipyrido (1,2-a) pyrimidin-4-onieetterijohdannaiset
Nya 9-hydroxypyrido (1,2-a) pyrimidin-4-oneterderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämä keksintö koskee uusia yhdisteitä, joilla on kaava (I),



niiden farmaseuttisesti hyväksyttävistä happoadditiosuoloista ja stereokemiallisesti isomeerisia muotoja, jolloin kaavassa Alk esittää C₁₋₄-alkaanidiyyliä; D on bisyklisen heterosykli, jolla on kaava (a) tai (b),



jolloin kukin R¹ on muista riippumatta C₂₋₆-alkenyylillä; C₂₋₆-alkynyylillä; C₃₋₆-sykloalkyyllä, joka on mahdollisesti substituoitu C₁₋₄-alkyyllillä; C₁₋₁₉-alkyyli, joka on mahdollisesti substituoitu C₃₋₆-sykloalkyyllillä, halogeeneilla, C₁₋₆-alkyloksilla tai syaanilla; ja kukin R² on muista riippumatta vety tai C₁₋₄-alkyyli. Kuvataan uudet yhdisteet, koostumukset ja menetelmät uusien yhdisteiden ja välituotteiden valmistami-

Föreliggande uppfinning avser nya föreningar med formeln (I) farmaceutiskt acceptabla syraadditionsalter och stereokemiskt isomera former av dem, varvid Alk är i formeln C₁₋₄-alkandiyl; D är en bicyklisk, heterocyklisk grupp med formeln (a) eller (b) vari varje R¹ är var för sig C₂₋₆-alkenyl; C₂₋₆-alkynyl; C₃₋₆-cykloalkyl, som är valbart substituerad med C₁₋₄-alkyl; C₁₋₁₉-alkyl, som är valbart substituerad med C₃₋₆-cykloalkyl, halogen, C₁₋₆-alkyloxi eller cyan; och varje R² är var för sig väte eller C₁₋₄-alkyl. Beskrivs nya föreningar, kompositioner och förfaranden för framställning av nya föreningar och mellanprodukter.