



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 971784

(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6

C 07D 405/14, A 61K 31/495

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 25.04.97

(24) Alkupäivä - Löpdag 19.10.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 25.04.97

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP95/04111

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

27.10.94 EP 94203120 P

31.05.95 US 455304 P

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Heeres, Jan, Leemskuilen 18, 2350 Vosselaar, Belgium, (BE)
2. Backx, Leo Jacobus Jozef, Broekstraat 92, 2370 Arendonk, Belgium, (BE)
3. Hendrickx, Robert Jozef Maria, Sint-Corneliusstraat 60, 2340 Beerse, Belgium, (BE)
4. Van der Eycken, Luc Alfons Leo, Maurice Pottersstraat 12, 2350 Vosselaar, Belgium, (BE)
5. De Chaffoy de Courcelles, Didier Robert, Guy Gabriel, Karel Van Nyenlaan 4, 2340 Beerse, Belgium, (BE)

(74) Asiamies - Ombud: Kolster Oy Ab, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Apolipoproteiini B-synteesin estäjiä
Apolipoprotein B-syntesinhibitorer

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee uudenlaisia yhdisteitä ja niiden N-oksidea ja stereokemiallisesti isomeerisiä muotoja sekä farmaseuttisesti hyväksyttäviä happoadditiosuoloja, joilla yhdisteillä on kaava I, jossa ryhmät A ja B muodostavat yhdessä bivalenttisen ryhmän jolla on kaava $-N=CH-$ (a), $-CH=N-$ (b), $-CH_2-CH_2-$ (c), $-CH=CH-$ (d), $-C(=O)-CH_2-$ (e) tai $-CH_2-C(=O)-$ (f); R^1 on vetyatomi, C_{1-6} -alkyyliryhmä tai halogeeniatomi; R^2 on vety- tai halogeeniatomi; R^3 on vetyatomi, C_{1-8} -alkyyli- tai C_{3-6} -sykloalkyyliryhmä tai hydroksyyli-, okso-, C_{3-6} -sykloalkyyli- tai alyyliryhmällä substituoitu C_{1-8} -alkyyli-ryhmä. Het on viisi- tai kuusijäseninen mahdollisesti substituoitu heterosyklinen rengas. Esille tuodaan myös käyttö lääkkeenä, erityisesti lipidejä vähentävänä aineena, samoin kuin farmaseuttisia koostumuksia ja menetelmiä yhdisteiden ja koostumusten valmistamiseksi.

Uppfinningen avser nya föreningar med formeln I, N-oxider, stereokemiskt isomera former och farmaceutiskt acceptabla syra-additionssalter av dem, vari grupperna A och B bildar tillsammans en tvåvärd grupp med formeln $-N=CH-$ (a), $-CH=N-$ (b), $-CH_2-CH_2-$ (c), $-CH=CH-$ (d), $-C(=O)-CH_2-$ (e) eller $-CH_2-C(=O)-$ (f); R^1 är en väteatom, en C_{1-6} -alkylgrupp eller en halogenatom; R^2 är en väte- eller halogenatom; R^3 är en väteatom, en C_{1-8} -alkyl- eller C_{3-6} -cykloalkylgrupp eller en med en hydroxyl-, oxo-, C_{3-6} -cykloalkyl- eller arylgrupp substituerad C_{1-8} -alkylgrupp. Het är en fem- eller sexledad, valfritt substituerad heterocyklisk ring. Föreliggande uppfinning avser även användning som ett läkemedel, speciellt som ett lipider minskande medel, samt farmaceutiska kompositioner och förfaranden för framställning av föreningar och kompositioner.

