[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 913532

(51) Kv.lk.5 - Int.cl.5

C 07D 211/22

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 23.07.91

(24) Alkupäivä - Löpdag 23.07.91

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 25.01.92

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

24.07.90 US 557855 P

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **McCarthy, James Ray**, 4668 Foxview Place, West Chester, Ohio 45069, USA, (US)
2. **Barney, Charlotte Louise**, 6152 Fairway Drive, Cincinnati, Ohio 45212, USA, (US)
3. **Wannamaker, Marion W.**, 7187 Heritage Drive, West Chester, Ohio 45069, USA, (US)

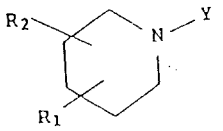
(74) Asiamies - Ombud: **Oy Kolster Ab**

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

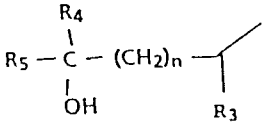
Uusia substituoituja piperidiineja ja niiden käyttö kolesterolin synteesin inhibiittoreina
Nya substituerade piperidiner och deras användning som inhibitorer av kolesterolsyntes

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämän keksinnön kohteena on ryhmä yhdisteitä, jotka ovat uusia substituoituja piperidiinejä ja inhiboivat kolesterolisynteesiä nisäkkäissä ja sienissä. Yhdisteillä on kaava:

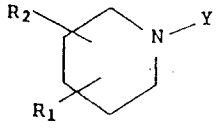


jossa Y on -A-(Alk_1)-D-(Alk_2)-E-(Alk_3)-CH_3, jossa A on $-CH_2-$, -C(=NR')- tai -CH(CH_3)-, tai -CH(CF_3)-; D ja E merkitsevät ryhmiä $-CH_2-$, -CH(R')-CH_2-, -N(R')-, -C(=O)-N(R")-, -C(=N-R")-, -N(R")-C(=O)-, -N(R")-C(=N-R")- tai suoraa sidosta, (Alk_1), (Alk_2) ja (Alk_3) merkitsevät mahdollisesti substituoitua suoraketjuista alkyleeniä tai alkenyleeniä, jossa voi olla yksi tai kaksi kaksoissidosta; R_1 on

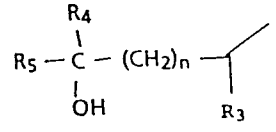


jossa R_3 on alkyyli, R_4 ja R_5 ovat vetyjä tai alkyylejä ja n on 0 tai kokonaisluku 1 - 3; R_2 on vety, hydroksi tai alkyyli; ja R', R" ja R''' ovat vetyjä tai alkyylejä.

Uppfinningen avser en grupp av föreningar, vilka är nya substituerade piperidiner och vilka fungerar som inhibitorer av kolesterolsyntesen hos däggdjur och svamp. Föreningarna har formeln:



där Y är -A-(Alk_1)-D-(Alk_2)-CH_3, där A är -CH_2-, -C(=NR')-, eller -CH(CH_3)-, eller -CH(CF_3)-; D och E betecknar grupper $-CH_2-$, -CH_2-N(R')-, -N(R')-, -C(=O)-N(R")-, -C(=N-R")-, -N(R")-C(=O)-, -N(R")-C(=N-R")- eller en direkt bindning, (Alk_1), (Alk_2) och (Alk_3) betecknar en eventuellt substituerad rakkedjad alkylen eller alkenylen, som kan innehålla en eller två dubbelbindningar; R_1 är



där R_3 är alkyl, R_4 och R_5 är väteatomer eller alkyler och n är ett heltal 1 - 3; R_2 är väte, hydroxi eller alkyl; och R', R" och R''' är väteatomer eller lägre alkyler.