



SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

|                                           |                |
|-------------------------------------------|----------------|
| (11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan | 935867         |
| (51) Kv.1k.5 - Int.cl.5                   |                |
| C 07D 223/16                              |                |
| (22) Hakemispäivä - Ansökningsdag         | 27.12.93       |
| (24) Alkuperä - Löpdag                    | 27.05.92       |
| (41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig | 27.12.93       |
| (86) Kv. hakemus - Int. ansökan           | PCT/US92/04197 |
| (32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet      |                |
| 28.06.91 JP 3-158832 P                    |                |

(71) Hakija - Sökande

1. Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, N.Y. 10017, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Ikeda, Takafumi, 1-51-7 Miyajicho, Handa-shi, Aichi 475, Japan, (JP)  
2. Hoshino, Yoko, 58 Takarami, Togasaki-cho, Nishio, Aichi 445, Japan, (JP)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Tetrahydrobentsatsepiini-johdannaisia, jotka estävät lipoksygenaasia**  
**Tetrahydrobentsazepinderivat som inhibiterar lipoxigenas**

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa n on 1 - 5; R on vety, C<sub>1-4</sub>-alkyyli, aryylialkyyli, jonka alkyyliosassa on 1 - 4 hiiliatomia, tai aryylialkyyli, jossa on yksi tai useampia substituentteja valittuina toisistaan riippumatta seuraavista: halogeeni, nitro, syaani, C<sub>1-6</sub>-alkyyli, C<sub>1-6</sub>-alkoksi, halogeenisubstituoitu C<sub>1-6</sub>-alkyyli, hydroksisubstituoitu C<sub>1-6</sub>-alkyyli, C<sub>2-7</sub>-alkoksikarbonyyli ja aminokarbonyyli, ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat inhiboivat lipoksygenaasientsyymiä ja ovat käyttökelpoisia sellaisten allergisten ja tulehdus- ja sydän-verisuonisairauksien käsittelyssä, joiden syntyy lipoksygenaasi on vaikuttanut. Nämä yhdisteet ovat aktiivisena aineosana tällaisten tautitilojen käsittelyyn käytettävissä farmaseuttisissa koostumuksissa.

Föreningar med formeln (I), vari n är 1 - 5 och R är väte, C<sub>1-4</sub> alkyl, arylalkyl med 1 - 4 kolatomer i alkyliden eller arylalkyl, substituerad med en eller flera substituent, självständigt valda ur gruppen bestående av halogen, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>1-6</sub>-alkoxi, C<sub>1-6</sub>-halogensubstituerad alkyl, C<sub>1-6</sub>-hydroxisubstituerad alkyl, C<sub>2-7</sub>-alkoxikarbonyl och aminokarbonyl, och de farmaceutiskt godtagbara salterna därav hämmar enzym lipoxigenas och är användbara i behandlingen av allergiska och inflammatoriska samt kardiovaskulära tillstånd, vilka uppstått genom inverkan av lipoxigenas. Dessa föreningar bildar den aktiva ingrediensen i farmaceutiska kompositioner för behandling av sådana tillstånd.

