



# PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

## [A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

SUOMI—FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11)(21) Patentihakemus—Patentansökan 864193  
(51) Kv.lk.<sup>4</sup>/Int.cl.<sup>4</sup> C 07 D 401/10, 413/10, 417/10  
(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 16.10.86  
(23) Alkupäivä—Löpdag  
(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 18.04.87  
(86) Kv. hakemus—Int.ansökan  
(30) Etuoikeus—Prioritet 17.10.85 GB 8525654  
23.01.86 GB 8601667

(71) Hakija/Sökande: *Smith Kline & French Laboratories Limited*, Mundeells, Welwyn Garden City, Hertfordshire, Iso-Britannia

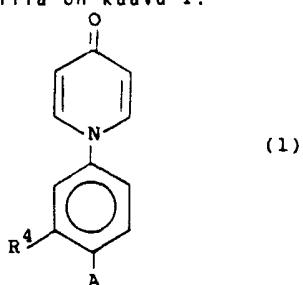
(72) Keksijä/Uppfinnare: Coates, William John

(74) Asiamies/Ombud: Berggren

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Menetelmä farmaseuttisesti aktivistien yhdisteiden valmistamiseksi. Förfarande för framtäckning av farmaceutiskt aktiva föreningar.

(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee menetelmää yhdisteiden valmistamiseksi, joilla on kaava 1:

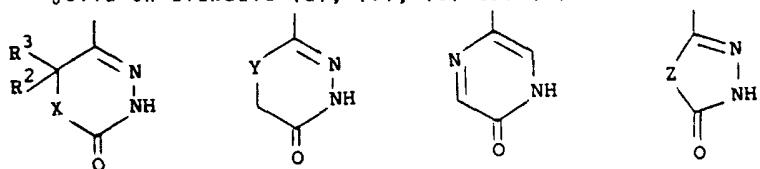


(1)

tai 1,2-etaanidiyyliryhmän. Näillä yhdisteillä on inotrooppisia, verisuonia laajentavia, keuhkoputkia laajentavia ja verihiutaleiden aggregoitumista estäviä ominaisuuksia.

Keksintö koskee myöskin väliuotteita kaavan 1 mukaisten yhdisteiden valmistamiseksi.

ja niiden farmaseuttisesti hyväksytävien suolojen valmistamiseksi, jossa A on ryhmä, jolla on alakaava (a), (b), (c) tai (d):

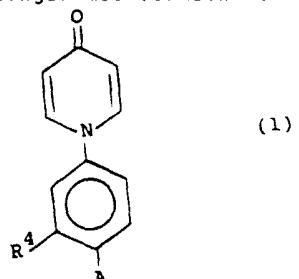


(a) X on  $\text{CHR}_1^1$ , rikki, happi tai  $\text{NH}$ ,  $\text{R}_1^1$  on vety tai  $\text{R}_2^2$  ja  $\text{R}_1^1$  muodostavat yhdessä siidoksen,  $\text{R}_2^2$  on vety tai metyyli tai  $\text{R}_3^3$  ja  $\text{R}_2^2$  muodostavat yhdessä sidoksen,  $\text{R}_3^3$  on vety tai muodostaa yhdessä  $\text{R}_4^4$  kanssa metyleeni- tai 1,2-etaanidiyyliryhmän, Y on rikki, happi tai  $\text{NH}$ , Z on rikki tai happi,  $\text{R}_4^4$  on vety tai se muodostaa yhdessä  $\text{R}_3^3$  kanssa metyleeni- tai 1,2-etaanidiyyliryhmän, edellyttäen että X on  $\text{CHR}_1^1$  tai rikki, kun  $\text{R}_4^4$  muodostaa yhdessä  $\text{R}_3^3$  kanssa metyleeni-

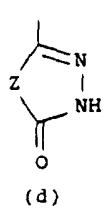
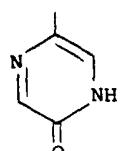
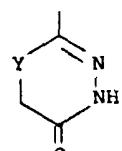
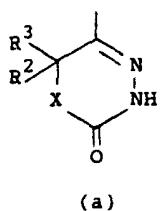
Jatkuu seur. sivulla  
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser förfaranden för framställning av föreningar med formeln 1:



och farmaceutiskt acceptabla salter därav,  
vari A en är grupp med subformeln (a), (b),  
(c) eller (d):



X är  $\text{CHR}^1$ , svavel, syre eller  $\text{NH}$ ,  $\text{R}^1$  är  
väte eller  $\text{R}^2$  och  $\text{R}^2$  bildar tillsammans  
en bindning,  $\text{R}^1$  är väte eller methyl eller  
 $\text{R}^3$  och  $\text{R}^4$  bildar tillsammans en bindning,  
 $\text{R}^4$  är väte eller bildar tillsammans med  
 $\text{R}^1$  en metylen- eller 1,2-etandiygrupp, Y är  
svavel, syre eller  $\text{NH}$ , Z är svavel eller syre,  
 $\text{R}^4$  är väte eller bildar tillsammans med  $\text{R}^3$   
en metylen- eller 1,2-etandiygrupp, förutsatt  
att X är  $\text{CHR}^1$  eller svavel då  $\text{R}^4$  bildar  
tillsammans med  $\text{R}^1$  en metylen- eller 1,2-  
etandiygrupp. Dessa föreningar har inotrop-  
iska, vasodilatoriska, bronkodilatoriska och  
trombocyttaggregationsinhiberande egenskaper.

Uppfinningen avser även mellanprodukter för  
framställning av föreningarna med formeln 1.