



S U O M I - F I N L A N D
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	930263
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07D 403/06	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	22.01.93
(24) Alkupäivä - Löpdag	12.06.91
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	22.01.93
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/US91/04043
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
24.07.90 US 557265 P	

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Goddard, Carl Joseph, 160 Morse Avenue, Groton, Conn. 06340, USA, (US)
2. Schulte, Gary Richard, 6 Williams Street, Stonington, Conn. 06378, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

3-(1-substituoituja pyratsoyyli)-2-oksi-indolijohdannaisia
3-(1-substituerade pyrazoyl)-2-oxi-indolderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämä keksintö koskee uusia 3-(1-substituoituja pyratsoyyli)-2-oksi-indolijohdannaisia, jotka ovat prostaglandiini-H₂-syntaasin, 5-lipo-oksigenaasin ja interleukiin-1:n biosynteesin estäjiä. Keksinnön mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia prostaglandiini-H₂-syntaasin ja interleukiini-1:n biosynteesin estäjinä sellaisenaan, ja kipulääkkeenä, tulehduksen vastaisina ja niveltulehduksen vastaisina aineina hoidettaessa kroonisia tulehdussairauksia. Tämä keksintö koskee myös farmaseuttisia koostumuksia, jotka käsittävät mainittuja 3-(1-substituoituja pyratsoyyli)-2-oksi-indolijohdannaisia; menetelmiä, joilla estetään prostaglandiini-H₂-syntaasia ja interleukiin-1:n biosynteesiä; sekä kroonisten tulehdussairauksien hoitoa nisäkkäessä mainituilla yhdisteillä. Edelleen tämä keksintö koskee uusia yhdisteitä, jotka ovat käyttökelpoisia välituotteina valmistettaessa tämän keksinnön mukaisia 3-(1-substituoituja pyratsoyyli)-2-oksi-indolijohdannaisia, sekä menetelmää, jolla valmistetaan 3-(1-substituoituja pyratsoyyli)-2-oksi-indolijohdannaisia.

Uppfinningen avser nya 3-(1-substituerade pyrazoyl)-2-oxindolderivat, vilka är prostalgins H₂-syntas-, 5-lipoxigenas- och interleukin-1-biosyntes-inhibitorer. Föreningarna enligt uppfinningen är användbara som prostaglandin H₂-syntas- och interleukin-1-biosyntes-inhibitorer, per se, och som analgesiska, antiinflammatoriska och antiarthritiska medel vid behandlingen av kroniska inflammationssjukdomar. Uppfinningen avser även farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller nämnda 3-(1-substituerade pyrazoyl)-2-oxindolderivat; förfaranden för hämmande av prostaglandin H₂-syntas och interleukin-1-biosyntes; och behandling av kroniska inflammatoriska sjukdomar hos ett däggdjur, med nämnda föreningar. Uppfinningen avser ytterligare vissa nya föreningar, vilka är användbara som mellanprodukter vid framställningen av de 3-(1-substituerade pyrazoyl)-2-oxindolderivaten enligt uppfinningen och ett förfarande för framställning av 3-(1-substituerade pyrazoyl)-2-oxindolderivaten.