



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 943646

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07D 313/08, C 07D 405/04

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 05.08.94

(24) Alkupäivä - Löpdag 07.12.93

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 05.08.94

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP93/03445

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

07.12.92 FR 9214720 P

(71) Hakija - Sökande

1. Merck Patent Gesellschaft mit beschränkter Haftung, Frankfurter Strasse 250,
64293 Darmstadt, BRD, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Berthelon, Jean-Jacques, 8 rue du Panorama, 69005 Lyon, France, (FR)
2. Brunet, Michel, 17 allée des Bleuets, 69780 Toussieu, France, (FR)
3. Noblet, Marc, 14 Petite rue de Montblaisir, 69008 Lyon, France, (FR)
4. Durbin, Philippe, 83 rue Paul Verlaine, 69100 Villeurbanne, France, (FR)
5. Guerrier, Daniel, Les Jardins de Saint-Genis, Batiment C, 35 route de Charly,
69230 Saint-Genis-Laval, France, (FR)
6. Luong, Trong Nghia, 469 Impasse des Ecureuils, Les Pins, 69140 Crepieux la Pape, France, (FR)

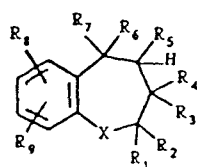
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Bentsosyklohepteenejä, bentsoksepiinejä bentsotiepiinejä
Bensosykloheptener, bensoxepiner och bensotiepiner

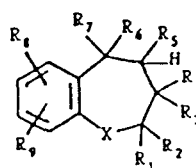
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee yhdisteitä, joilla on
yleinen kaava:



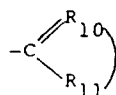
I

Uppfinningen avser föreningar med den
allmänna formeln I,



I

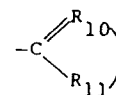
jossa X on O tai CHR; R_1 , R_2 , R_3 ja R_4 , jotka ovat samanlaiset tai erilaiset, merkitsevät vetyatomia tai C_{1-7} -alkyyli-ryhmää, jolloin on mahdollista, että R_1 lisäksi muodostaa sidoksen R_2 :n kanssa; R_5 on vety-atomia, hydroksyyli-ryhmä tai R_5 muodostaa yhdessä R_2 :n kanssa sidoksen tai ryhmän $\begin{matrix} \diagup O \\ \diagdown \end{matrix}$; R_6 on ryhmä, jolla on kaava:



jossa R_{10} ja R_{11} muodostavat yhdessä hiili-atomin kanssa, johon ne ovat kiinnittyneet, tyypillisen heterosyklisen ryhmän, ja niiden N-oksidi- ja farmaseuttisesti hyväksyttävissä suoloja.

Nämä yhdisteet ovat tehokkaita kaliumkanavien aktivaattoreita.

vari X är O eller CHR, R_1 , R_2 , R_3 och R_4 , vilka är identiska eller olika, är en väteatom eller en C_{1-7} -alkylgrupp, varvid det är möjligt för R_1 att ytterligare bilda en bindning med R_2 ; R_5 är en väteatom, en hydroxylgrupp eller R_5 och R_2 bildar tillsammans en bindning eller en $\begin{matrix} \diagup O \\ \diagdown \end{matrix}$ -grupp R_6 är en grupp med formeln



vari R_{10} och R_{11} tillsammans med kolatomen, vid vilken de är bundna, bildar en kvävehaltig heterocyklisk grupp, och deras N-oxider och farmaceutiskt godtagbara salter. Dessa föreningar är effektiva kaliumkanalakтивatorer.