



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 911353

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

C 12P 17/18, C 07D 493/08
C 12N 1/16

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.03.91

(24) Alkuperä - Löpdag 20.03.91

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 22.09.91

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

21.03.90 US 496731 P
21.03.90 US 496749 P

21.03.90 US 496742 P
11.12.90 US 626071 P

(71) Hakija - Sökande

1. Merck & Co., Inc., 126 E. Lincoln Avenue, Rahway, N.J., USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Bergstrom, James D., 60 Rohill Road, Neshanic, N.J. 08853, USA, (US)
2. Hensens, Otto D., 65 Alexander Drive, River Plaza, Red Bank, N.J. 07701, USA, (US)
3. Huang, Leeyuan, 33 Will Lane, Watchung, N.J. 07060, USA, (US)
4. Liesch, Jerrold M., 10 Sherbrooke Drive, Princeton Junction, N.J. 08550, USA, (US)
5. Onishi, Janet C., 350 Cherry Hill Road, Mountainside, N.J. 07092, USA, (US)
6. Vanmiddlesworth, Frank L., 199 Second Street, Fanwood, N.J. 07023, USA, (US)
7. Diez, Maria T., C/ Olid, 4, 28010 Madrid, Espana, (ES)
8. Nallin, Mary, 634 Westfield Avenue, Westfield, N.J. 07090, USA, (US)
9. Pelaez Perez, Fernando, C/ Camino Valderribas n 110, 4-C, 28038 Madrid, Espana, (ES)
10. Bartizal, Kenneth F., 16 Lilac Lane, Somerset, N.J. 08873, USA, (US)
11. Rozdilsky, Walter, 949 North Concourse, Cliffwood Beach, N.J. 07735, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

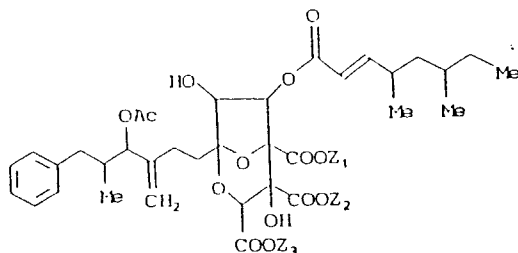
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Uusia skvaleenisyntetaasin inhibiittoreita
Nya skvalensyntetasinhibitorer

(83) Mikro-organismitalletus - Deposition av mikroorganism: 20986 ATCC

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

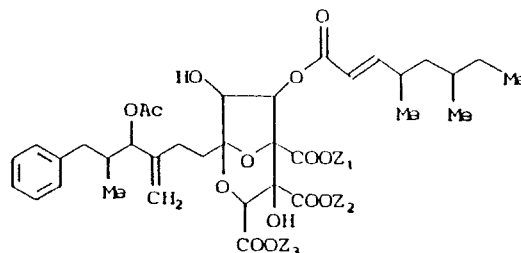
Keksintö koskee yhdisteitä, joilla on rakennekaava I:



(I)

jossa Z_1 , Z_2 ja Z_3 kukin toisista riippumatta on (a) H, (b) C_{1-5} -alkyyli tai (c) C_{1-5} -alkyyli, joka on substituoitu (i) fenyyllillä tai (ii) metyyllillä metoksyylillä, halogeenilla tai hydroksyyllillä substituoitulla fenyyllillä, ja näiden yhdisteiden farmaseuttisesti hyväksyttäviä suoloja. Keksintö koskee edelleen menetelmää yhdisteiden valmistamiseksi viljelemällä mikro-organismia MF 5453, ATCC 20986 tai sen mutanttia. Uudet yhdisteet ovat käyttökelpoisia hyperkolesterolemian hoidossa ja sienten kasvun estossa.

Uppfinningen avser föreningar med strukturformeln I,



(I)

vari Z_1 , Z_2 och Z_3 oberoende av varandra är (a) H, (b) C_{1-5} -alkyl, eller (c) C_{1-5} , som är substituerad med (i) fenyl eller (ii) med metyl, metoxyl, halogen eller med hydroxysubstituerad fenyl och de farmaceutiskt godtagbara salterna av dessa föreningar. De nya föreningarna är användbara vid behandling av hyperkolesterolemi och hämmande av svampväxt. Uppfinningen avser ytterligare ett förfarande för framställning av föreningarna genom odling av mikroorganismen MF 5453, ATCC 20986 eller dess mutant.