



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan **935897**

(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5

C 07D 471/04 // (C 07D 471/04, 221:00, 239:00)

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag **28.12.93**

(24) Alkupäivä - Löpdag **28.12.93**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig **30.06.94**

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

29.12.92 JP 4-360384 P

05.11.93 JP 5-277136 P

(71) Hakija - Sökande

1. Takeda Chemical Industries, Ltd., 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka 541, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Furuya, Shuichi, 7-9-603, Kasuga 1-chome, Tsukuba, Ibaraki 305, Japan, (JP)

2. Ohtaki, Tetsuya, 7-9-802, Kasuga 1-chome, Tsukuba, Ibaraki 305, Japan, (JP)

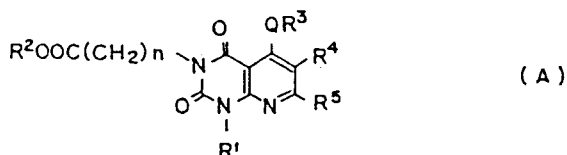
(74) Asiamies - Ombud: Oy Borenus & Co Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Pyridopyrimidiinijohdannaiset, niiden valmistus ja käyttö
Pyridopyrimidinderivat deras framställning och användning

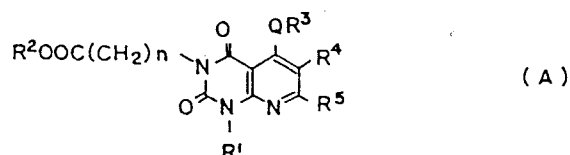
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksinnön kohteena on uusi kaavan (A)



mukainen pyrido[2,3-d]pyrimidiinijohdannainen tai sen suola, jossa kaavassa n on kokonaisluku 0-3, Q on $-(CH_2)_m-$ (m tarkoittaa kokonaislukua 0-2), -O-, -S(O)p- (p tarkoittaa kokonaislukua 0-2) tai -NH-, ja $R^1 - R^6$ ovat substituentteja. Yhdisteiden valmistus ja niiden käyttö endoteeliinireseptori-antagonisteina esitetään. Yhdisteestä koostuva endoteeliinireseptori-antagonisti on tehokas terapeuttisena aineena munuaisten vajaatoiminnasta, sydänlihassinfarktista, kohonneesta verenpaineesta, aivoinfarktista, angina pectoriksesta, valtimonkovetustaudista, maksataudista, keuhkojen kohonneesta verenpaineesta, bronkiaalisesta astmasta tai leikkausten tai elinten siirtojen yhteydessä esiintyvistä elinten vajaatoiminnasta kärsivän potilaan hoitamiseksi.

Uppfinningen avser ett nytt pyrido[2,3-d]pyrimidinderivat med formeln (A) eller dess salt



där n betecknar ett helt tal 0-3, Q betecknar $-(CH_2)_m-$ (m betecknar ett helt tal 0-2), -O-, -S(O)p- (p betecknar ett helt tal 0-2) eller -NH-, och $R^1 - R^6$ betecknar substituentter. Framställning av föreningarna samt deras användning som endotelinreceptorantagonister beskrivs. En endotelinreceptorantagonist bestående av nämnda förening är effektiv som ett terapeutiskt medel vid skötsel av patienter med akut njurinsufficiens, myokardisk infarkt, hypertension, hjärninfarkt, angina pectoris, arteioskleros, hepatopati, pulmonär hypertension, bronkial astma eller organhypofunktion som uppstår vid operation eller transplantation av organ.