[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) **Patenttihakemus - Patentansökan** 972460

(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6

C 07C 279/18, 279/30, 335/16
C 07D 295/135, A 61K 31/155, 31/27
31/275, 31/195, 31/21, 31/40

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag **10.06.1997**

(24) Alkupäivä - Löpdag **12.12.1995**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig **11.08.1997**

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan **PCT/JP95/02540**

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

12.12.1994 JP 6-336795 P 07.06.1995 WO PCT/JP95/01135

(71) Hakija - Sökande

1. **Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha**, 5-1, Ukima 5-chome, Kita-ku, Tokyo 115, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **Honda, Toshio**, 5-41-1-503, Takinogawa, Kita-ku, Tokyo 114, Japan, (JP)
2. **Makino, Toshihiko**, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha, 135, Komakado 1-chome, Gotenba-shi, Shizuoka 412, Japan, (JP)
3. **Nagafuji, Toshiaki**, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha, 135, Komakado 1-chome, Gotenba-shi, Shizuoka 412, Japan, (JP)
4. **Kitoh, Yasushi**, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha, 135, Komakado 1-chome, Gotenba-shi, Shizuoka 412, Japan, (JP)
5. **Kimura, Nobuaki**, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha, 135, Komakado 1-chome, Gotenba-shi, Shizuoka 412, Japan, (JP)

(74) Asiamies - Ombud: **Kolster Oy Ab**, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

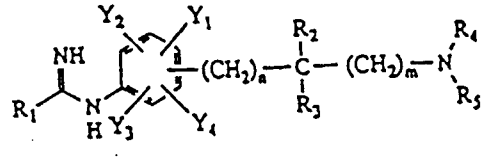
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Aniliinijohdannaiset joilla on typpimonoksidisyntaasiesto aktiivisuus**
**Anilidinderivat med nitrogenmonoxidsyntasinhibitor aktivitet**

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Yhdiste, joka esitetään yleisellä kaavalla (1), tai sen mahdolliset stereoisomeerit ja optiset isomeerit, ja näiden lääkinnällisesti hyväksyttävät suolat (joissa $R_1$ on $SR_6$ tai $NR_7R_8$; $R_6$ on $C_{1-6}$-alkyyli, jne.; $R_7$ on vety, $C_{1-6}$-alkyyli tai nitro; $R_8$ on vety tai $C_{1-6}$-alkyyli; $R_2$ ja $R_3$ ovat kukin vety, $C_{1-6}$-alkyyli, jne.; $R_4$ on vety, $C_{1-6}$-alkyyli tai amidino, jossa amiiniryhmä voi olla substituoitu alkyylillä tai nitrolla; $R_5$ on vety tai $C_{1-6}$-alkyyli; $Y_1$, $Y_2$, $Y_3$ ja $Y_4$ voivat olla samoja tai erilaisia ja kukin on vety, halogeeni, $C_{1-6}$-alkoksi, jne.; ja n ja m ovat kukin kokonaisluku 0 tai 1). Yhdisteellä on voimakas typpimonoksidisyntaasia inhiboiva aktiivisuus ja se on käyttökelpoinen lääkkeenä aivoverisuonisairauksia varten.

En förening med den allmänna formeln (1) eller dess eventuella stereoisomerer och optiska isomerer och medicinskt acceptabla salter av dessa (vari $R_1$ är $SR_6$ eller $NR_7R_8$; $R_6$ är $C_{1-6}$-alkyl, etc.; $R_7$ är väte, $C_{1-6}$-alkyl eller nitro; $R_8$ är väte eller $C_{1-6}$-alkyl; $R_2$ och $R_3$ är vardera väte, $C_{1-6}$-alkyl etc.; $R_4$ är väte, $C_{1-6}$-alkyl eller amidino, vari amingruppen kan vara substituerad med alkyl eller nitro; $R_5$ är väte eller $C_{1-6}$-alkyl; $Y_1$, $Y_2$, $Y_3$ och $Y_4$ kan vara lika eller olika och var och en är väte, halogen, $C_{1-6}$-alkoxi etc.; och n och m är vardera ett heltal 0 eller 1). Föreningen är en potent inhibitor av kvävemonoxidsyntesen och den kan användas som läkemedel för cerebrovaskulära sjukdomar.




(1)