



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 944802
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07K 5/06
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 12.10.94
(24) Alkupäivä - Löpdag 15.04.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 12.10.94
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/GB93/00794
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
16.04.92 GB 9208379 P 16.04.92 GB 9208380 P
08.07.92 GB 9214448 P 14.08.92 GB 9217362 P
14.08.92 GB 9217363 P 14.08.92 GB 9217364 P

(71) Hakija - Sökande

1. Zeneca Limited, Imperial Chemical House, 9 Millbank, London SW1P 3JF, United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Bernstein, Peter Robert, 14 Forest View Road, Wallingford, Pa. 19086-6721, USA, (US)
2. Thomas, Royston Martin, 71 Abbey Road, Macclesfield, Cheshire SK10 3AT, United Kingdom, (GB)
3. Warner, Peter, 25 Barnside Way, Macclesfield, Cheshire SK10 2TZ, United Kingdom, (GB)
4. Wolanin, Donald John, 320 Longmeadow Road, Orange, Conn. 06477, USA, (US)

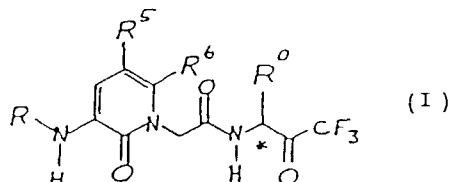
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

HLE-proteiinien aktiivisuutta inhiboivat laktaamidipeptidit
Laktamidpeptider med HLE inhiberande aktivitet

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Esillä oleva keksintö koskee tiettyjä uusia heterosyklisiä yhdisteitä, jotka ovat tässä kuvatun kaavan (I)



mukaisia 1-pyridyylasetamidiyhdisteitä, jotka ovat ihmisen leukosyyttielastaasin (HLE) inhibiittoreita, joka myös tunnetaan nimellä ihmisen neutrofiilielastaasi (HNE), joka tekee ne käyttökelpoisiksi hah-
luttaessa sellainen inhibitio, kuten tutkimusvälineeksi farmakologisiin, diagnostisiin ja niille sukua oleviin tutkimuksiin ja sellaisen nisäkästautien hoitoon, joihin HLE-proteiini ottaa osaa. Keksintö sisältää myös välimuodot, jotka ovat käyttökelpoisia näiden heterosyklisten yhdisteiden synteesissä, menetelmät heterosyklisten yhdisteiden valmistamiseksi, farmaceutiset koostumukset, jotka sisältävät sellaisia heterosyklisiä yhdisteitä, ja menetelmät niiden käyttämiseksi.

Föreliggande uppfinning avser vissa nya heterocykliska föreningar, vilka är 1-pyridylacetamidföreningar med formeln (I), angiven här, och vilka är inhibitorer för human leukocytelastas (HLE), även känd som human neutrofilelastas (HNE), vilket gör dem användbara, närhelst sådan hämning önskas, såsom forskningsredskap i farmakologiska, diagnostiska och därmed besläktade studier och i behandlingen av sjukdomar hos däggdjur, vari HLE påvisats. Uppfinningen omfattar även mellanprodukter, vilka är användbara i syntesen av dessa heterocykliska föreningar, förfaranden för framställning av de heterocykliska föreningarna, farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller sådana heterocykliska föreningar och förfaranden för deras användning.