



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 972661

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

C 07D 241/02, 401/12, 471/04
A 61K 31/495

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 19.06.97

(24) Alkupäivä - Löpdag 22.12.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 22.08.97

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/GB95/03029

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

23.12.94 GB 9426090 P

(71) Hakija - Sökande

1. Xenova Limited, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Ashworth, Philip Anthony, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)
2. Hunjan, Sukhjit, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)
3. Pretswell, Ian Andrew, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)
4. Ryder, Hamish, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)
5. Brocchini, Stephen James, 240 Bath Road, Slough, Berkshire SL1 4EF, United Kingdom, (GB)

(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab, Jaakonkatu 3 A, 00100 Helsinki

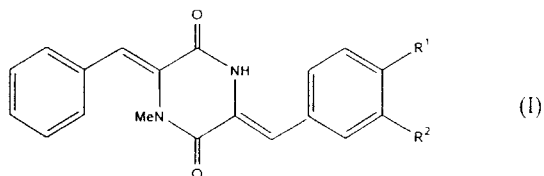
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Monilääkeresistanssia moduloivat piperatsiini-2,5-dionijohdannaiset
Piperazin-2,5-dioniderivat som modulerar multiläkemedelsresistans

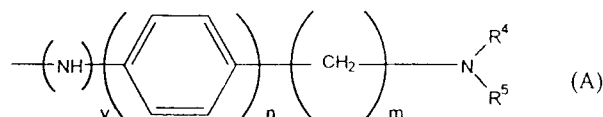
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö kohdistuu piperatsiinidioniin, jolla on yleinen kaava (I), jossa R^1 on vety; ryhmä, jolla on kaava $-\text{COR}^3-(\text{NH})_t-\text{COR}^3$, jossa t on 0 tai 1 ja R^3 on (i): (A), jossa v on 0 tai 1, kun t on 1 ja v on 1, kun t on 0; ja jossa n on 0, 1, 2 tai 3, jolloin ainakin toinen n :stä tai m :stä on muu kuin 0, ja joko (ii): (B), jossa p on 1 tai 2 ja Z on $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkenyli tai fenyyliryhmä, joka mahdollisesti on substituoitu $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoksilla; tai (iii): (C), jossa R^9 on $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkyyli, pyrimidinyli tai fenyyl, mahdollisesti substituotuna $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoksilla tai (F) ja R^2 on vety tai ryhmä, jolla on kaava $-\text{COR}^3$ kuten edellä on määritelty, edellyttäen, että toinen R^1 :stä ja R^2 :stä on vety ja toinen muu kuin vety; ja sen farmaseuttisesti hyväksyttäviin suoloihin, jotka ovat aktiivisia monilääkeresistanssimodulaattoreita.

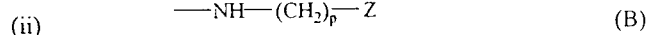
Uppfinningen avser en piperazindion med den allmänna formeln (I) i vilken R^1 är väte; en grupp med formeln $-\text{COR}^3-(\text{NH})_t-\text{COR}^3$ i vilken t är 0 eller 1 och R^3 är (i): (A) i vilken v är 0 eller 1 då t är 1 och v är 1 då t är 0; och i vilken n är 0, 1, 2 eller 3 då minst den ena av n eller m är annan än 0 och antingen (ii): (B) i vilken p är 1 eller 2 och Z är $\text{C}_2\text{-C}_6$ -alkenyl eller en fenyylgrupp eventuellt substituerad med $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoxi, eller (iii): (C) i vilken R^9 är $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkyl, pyrimidinyl eller fenyyl, eventuellt substituerad med $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alkoxi eller (F) och R^2 är väte eller en grupp med formeln $-\text{COR}^3$ så som definierats ovan, förutsatt att den ena av R^1 och R^2 är väte och den andra något annat än väte; samt farmaceutiskt acceptabla salter därav som är aktiva som modulatorer av multiläkemedelsresistans.



(I)



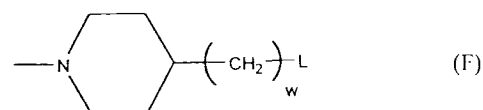
(A)



(B)



(C)



(F)