[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 952033

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

A 61K 31/505, C 07D 487/04

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 28.04.95

(24) Alkupäivä - Löpdag 28.04.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 04.11.95

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

03.05.94 CH 1385/94 P 30.01.95 CH 245/95 P

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(71) Hakija - Sökande

1. **Ciba-Geigy AG**, Klybeckstrasse 141, 4002 Basel, Switzerland, (CH)

(72) Keksijä - Uppfinnare

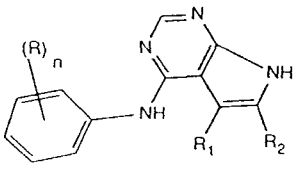
1. **Traxler, Peter**, Bündtenring 3, 4124 Shönenbuch, Switzerland, (CH)
2. **Furet, Pascal**, Rue du Riegelsbourg 24, 68800 Thann, France, (FR)
3. **Brill, Wolfgang K.-D**, Hans-Vetter-Strasse 137, 79650 Schopfheim, Germany, (DE)

(74) Asiamies - Ombud: **Oy Jalo Ant-Wuorinen Ab**

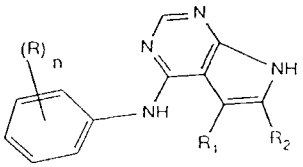
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Farmakologisesti aktiiviset pyrrolopyrimidiinijohdannaiset**
**Farmakologiskt aktiva pyrrolopyrimidinderivat**

(57) Tiivistelmä - Sammandrag



(I)



(I)

Keksintö koskee kaavan (I) mukaisia uusia yhdisteitä, joissa n on 0 - 5 ja, kun n ei ole 0, R on yksi tai useita substituentteja, joita ovat halogeeni, alkyyli, trifluorimetyyli ja alkoksi; ja $R_1$ ja $R_2$ ovat toisistaan riippumatta alkyyli tai fenyyli, joka on substituoimaton tai substituoitu halogeenilla, trifluorimetyylillä, alkyylillä tai alkoksilla, jolloin on myös mahdollista, että toinen tähteistä $R_1$ ja $R_2$ on vety tai $R_1$ ja $R_2$ muodostavat yhdessä alkyleeniketjun, jossa on 2 - 5 hiiliatomia ja joka on substituoimaton tai substituoitu alkyylillä; ja niiden suoloja, ja näiden käyttöä hoidettaessa terapeuttisesti kasvainsairauksia ja muita proliferatiivisia sairauksia, kuten psoriasista. Kaavan (I) mukaiset yhdisteet estävät proteiinikinaaseja, esimerkiksi epidermisen kasvutekijän, EGF, reseptorin tyrosiiniproteiinikinaasia.

Uppfinningen avser nya föreningar med formeln (I), där n är 0 - 5 och, när n inte är 0, R är en eller flera substituenter, som är en halogen, alkyl, trifluormetyl och alkoxi; och $R_1$ och $R_2$ är oberoende av varandra alkyl eller fenyl, som är osubstituerad eller substituerad med halogen, trifluormetyl, alkyl eller alkoxi, varvid det också är möjligt, att den ena av radikalerna $R_1$ och $R_2$ är väte, eller $R_1$ och $R_2$ tillsammans bildar en alkylenkedja med 2 - 5 kolatomer, som är osubstituerad eller är substituerad med en alkyl; och deras salter, och användning av föreningarna vid terapeutisk behandling av tumörsjukdomar och andra proliferativa sjukdomar, såsom psoriasis. Föreningarna med formeln (I) hämmar proteinkinaser, t.ex. tyrosinproteinkinas av receptorn för den epidermala tillväxtfaktorn EGF.