



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	945907
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07D 405/06	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	15.12.94
(24) Alkuperäisyys - Löpdag	14.06.93
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	15.12.94
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/EP93/01520
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
17.06.92 GB 9212833 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Glaxo Group Limited, Glaxo House, Berkeley Avenue, Greenford, Middlesex UB6 0NN, United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Cherry, Peter Clive, Glaxo Research and Development Limited, Greenford Road, Greenford, Middlesex UB6 0HE, United Kingdom, (GB)
2. Foxton, Michael Walter, Glaxo Research and Development Limited, Greenford Road, Greenford, Middlesex UB6 0HE, United Kingdom, (GB)
3. Merritt, Andrew Thomas, Glaxo Research and Development Limited, Greenford Road, Greenford, Middlesex UB6 0HE, United Kingdom, (GB)

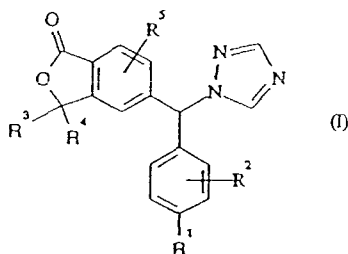
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Kemiallisia yhdisteitä
Kemiska föreningar

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämä keksintö koskee heterosyklisiä yhdisteitä, jotka ovat aromataasientsyymin estäjiä, menetelmiä niiden valmistamiseksi, niitä sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia sekä niiden käyttöä lääketieteessä. Erityisiä keksinnön yhdisteitä ovat yhdisteet, joiden kaava on (I)



jossa R¹ on syaani- tai nitroriippä; R² on vety tai yksi tai useampi halogeeniatomi; R³ on C₁₋₆-alkyyli- tai alkoxyryhmä ja R⁴ on vety tai C₁₋₆-alkyyli- tai alkoxyryhmä, tai R³ ja R⁴ muodostavat yhdessä C₃₋₆-sykloalkyyli- tai alkoxyryhmän; ja R⁵ on vety tai yksi tai useampi halogeeniatomi tai C₁₋₆-alkoksyryhmä, sekä niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat ja solvaatit.

Föreliggande uppfinning avser heterocykliska föreningar, vilka är aromatasenzyminhibitorer, förfaranden för framställningen av dem, farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller dem samt deras användning inom medicinen. Speciella föreningar enligt uppfinningen är föreningar med formeln (I), vari R¹ är en cyano- eller nitrogrupp; R² är väte eller en eller flera halogenatomer; R³ är en C₁₋₆-alkylgrupp och R⁴ är väte eller en C₁₋₆-alkylgrupp eller R³ och R⁴ bildar tillsammans en C₃₋₆-cykloalkylgrupp; och R⁵ är väte eller en eller flera halogenatomer eller C₁₋₆-alkoxygrupper, samt deras farmaceutiskt godtagbara salter och solvater.