



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 925167
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5
C 07D 275/06, 417/12, 513/04, 417/14, 471/04
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 13.11.92
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 13.11.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 16.05.93
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
15.11.91 US 793033 P

(71) Hakija - Sökande

1. Sterling Winthrop Inc., 90 Park Avenue, New York, N.Y. 10016, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Dunlap, Richard Paul, 1864 Harris Road, Penfield, N.Y. 14526, USA, (US)
2. Boaz, Neil Warren, 107 Virginia Avenue, Waterloo, N.Y. 13165, USA, (US)
3. Mura, Albert Joseph, 334 Ballad Avenue, Rochester, N.Y. 14626, USA, (US)
4. Hlasta, Dennis John, 3 Maurice Lane, Clifton Park, N.Y. 12065, USA, (US)
5. Desai, Ranjit Chimanlal, 9 Rafaillo Drive, Latham, N.Y. 12110, USA, (US)
6. Subramanyam, Chakrapani, 2102 Coventry Lane, East Greenbush, N.Y. 12061, USA, (US)
7. Latimer, Lee Hamilton, 12 Birmingham Drive, Rochester, N.Y. 14618, USA, (US)
8. Lodge, Eric Piatt, 2141 Holly Berry Court, Pottstown, Pa. 19464, USA, (US)

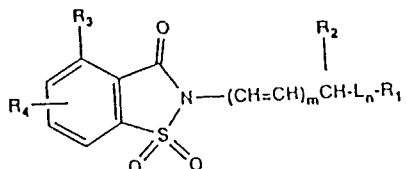
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

2-substituoituja sakkariinijohdannaisia, jotka ovat proteolyttisten entsyymien inhibiittoreita
2-substituerade sackarinderivat, som är inhibitorer för proteolytiska enzymer

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee menetelmää uusien 2-ase-
masta substituoitujen sakkariinien, val-
mistamiseksi jotka inhiboivat proteolytt-
tisten entsyymien entsyymaattista aktiivi-
suutta, jotka ovat käyttökelpoisia rappeu-
tumissairauksien hoidossa ja joilla on
kaava I



jossa L on -O-, -S-, -SO- tai -SO₂-, m ja n ovat itsenäisesti 0 tai 1, R₁ on substituoitu fenyyli, heterosyklyyli tai substituoitu heterosyklyyli, tai silloin kun L on -O- ja n on 1, niin R₁ on sykloheptatrienon-2-yyli, tai silloin kun L on -S- ja n on 1, niin R₁ on syaani tai (alempi alkoksi)tiokarbonyyli, tai silloin kun L on -SO₂- ja n on 1, niin R₁ on alempi alkyylili tai trifluorimetyyli, R₂ on vety, (alempi alkoksi)karbonyyli, fenyyli tai fenyyliitio ja R₃ ja R₄ ovat vetyjä tai eri substituenteja, sekä menetelmiä yhdisteen valmistamiseksi, jota voidaan käyttää välituotteena kaavan I mukaisten yhdisteiden val-

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av nya 2-substituerade sackariner, vilka hämmar den enzymatiska aktiviteten i proteolytiska enzymer och är användbara vid behandlingen av degenerativa sjukdomar och har formeln I, vari L är -O-, -S-, -SO- eller -SO₂-; m och n är självständigt 0 eller 1; R₁ är substituerad fenyl, heterocyklyl eller substituerad heterocyklyl eller, när L är -O- och n är 1: är R₁ cykloheptatrienon-2-yl eller, när L är -S- och n är 1, är R₁ cyano eller lägre alkoxitiokarbonyl eller, när L är -SO₂- och n är 1, är R₁ lägre alkyl eller trifluormetyl R₂ är väte, lägre alkoxikarbonyl, fenyl eller fenylitio; och R₃ och R₄ är envar väte eller olika substituenten samt förfaranden för framställning av en förening, vilken kan användas som mellanprodukt vid framställningen av föreningarna med formeln I.