



SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	960399
(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6	
C 07D 209/44, A 61K 31/40	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	29.01.96
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	28.07.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	29.01.96
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/FR94/00952
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
30.07.93 FR 9309400 P	07.10.93 FR 9311946 P

(71) Hakija - Sökande

1. Rhone-Poulenc Rorer S.A., 20, avenue Raymond Aron, 92160 Antony, France, (FR)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Achard, Daniel, 26, rue Adrien-Tessier, 94320 Thiais, France, (FR)
2. Grisoni, Serge, 17, rue Babeuf, 94600 Choisy-le-Roi, France, (FR)
3. James-Surcouf, Evelyne, 3, allée Louis-de-Broglie, 77150 Lesigny, France, (FR)
4. Malleron, Jean-Luc, 2, allée Renoir, 91460 Marcoussis, France, (FR)
5. Morgat, Anne, 14, rue Rene-Anjoly, 94250 Gentilly, France, (FR)
6. Peyronel, Jean-Francois, 6, parc d'Ardenay, 91120 Palaiseau, France, (FR)
7. Sabuco, Jean-Francois, 52, rue Maurepas, 94320 Thiais, France, (FR)
8. Tabart, Michel, Tour Athenes, 75, rue du Javelot, 75013 Paris, France, (FR)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

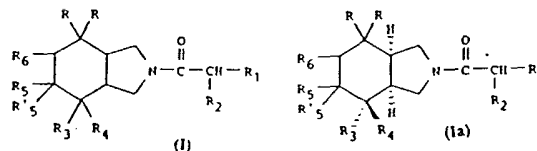
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Perhydroisoindolijohdannaisia P-aineen antagonisteina  
Perhydroisoindolderivat som P-substansantagonister

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Uusia perhydroisoindolijohdannaisia, joiden yleinen kaava on (I), jossa R<sub>1</sub> on fenyyli, joka on mahdollisesti substituoitu, sykloheksadienyylillä, naftyyli, indenyyli, tai mahdollisesti substituoitu heterosyklyyli, R<sub>2</sub> on H, halogeeni, OH, alkyylillä, aminoalkyyli, alkyyliaminoalkyyli, dialkyyliaminoalkyyli, alkyylioksi, alkyylitio, asyylioksi, karboksi, mahdollisesti substituoitu alkyylioksikarbonyyli, bentsoyylisoksikarbonyyli, amino tai asyyliamino, R<sub>3</sub> on fenyyliiradikaali, joka on mahdollisesti substituoitu asemassa -2 alkyylillä tai alkyylioksilla (1 tai 2C) tai fluoriatomilla, tai disubstituoitu trifluorimetyyllillä, ja R<sub>5</sub> ja R'<sub>5</sub> ovat identtiset tai erilaiset ja niistä yksi on H tai OH tai alkyylillä ja toinen on H tai alkyylillä, ja R<sub>4</sub> on OH, tai sitten R<sub>4</sub> on F, jos symbolit R<sub>5</sub> ja R'<sub>5</sub> ovat H-atomeja tai alkyyylejä, tai sitten R<sub>4</sub> muodostaa R<sub>5</sub>:n kanssa sidoksen, ja R<sub>6</sub> on H tai alkyylillä, hydroksi tai hydroksialkyylillä, ja symboleista R yksi on H, alkyylillä, hydroksi tai hydroksialkyylillä ja

toinen on H, alkyylillä, fenyyli tai hydroksialkyylillä, isomeerisissä muodoissaan, joiden rakenne on (Ia), tai näiden seoksina, mahdollisesti suoloinaan, milloin näitä esiintyy, sekä niiden valmistus. Keksinnön mukaiset uudet johdannaiset ovat erityisen kiinnostavia aine-P-antagonisteina.



Jatkuu seur. sivulla  
Forts. nästa sida

Nya perhydroisindolderivat med den allmänna formeln (I), vari  $R_1$  är eventuellt substituerad fenyl, cyklohexadienyl, naf-tyl, indenyl eller eventuellt substituerad heterocyklyl;  $R_2$  är H, halogen, OH, alkyl, aminoalkyl, alkylaminoalkyl, dialkylaminoalkyl, alkyloxi, alkyltio, acyloxi, karboxi, eventuellt substituerad alkokikarbonyl, bensyloxikarbonyl, amino eller acyl-amino; och  $R_3$  är en fenylradikal, som eventuellt är substituerad i 2-ställning med alkyl eller alkyloxi (1 eller 2C) eller med en fluoratom eller disubstituerad trifluormetyl; och  $R_5$  och  $R'_5$  likadana eller olika och en av dem är H eller OH eller alkyl, och den andra är H eller alkyl, och  $R_4$  är OH, eller så är  $R_4$  F, om symbolerna  $R_5$  och  $R'_5$  är H-atomer eller alkyler, eller så bildar  $R_4$  en bindning med  $R_5$ , och  $R_6$  är H eller alkyl, hydroxi eller hydroxialkyl, och av symbolerna R är en H, alkyl, hydroxi eller hydroxialkyl, och den andra H, alkyl, fenyl eller hydroxialkyl, i deras isomera former, vilkas struktur är (Ia), eller som blandningar av dessa, eventuellt som salter ifall dessa förekommer, samt framställning av dessa. Derivatet enligt uppfinningen är speciellt intressanta som P-ämnesantagonister.

