



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 934460
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07D 211/04, 213/04, 295/04, 401/04
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 11.10.93
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 11.10.93
(41) Tulnut julkiseksi - Blivit offentlig 13.04.94
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
12.10.92 DE 4234295 P

(71) Hakija - Sökande

1. Dr. Karl Thomae Gesellschaft mit beschränkter Haftung, 88397 Biberach/Riss, BRD, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Pieper, Helmut, Kapellenweg 5, 88400 Biberach, BRD, (DE)
2. Linz, Günter, Erlenweg 8, 88441 Mittelbiberach, BRD, (DE)
3. Himmelsbach, Frank, Ahornweg 16, 88441 Mittelbiberach, BRD, (DE)
4. Austel, Volkhard, Kapellenweg 7, 88400 Biberach, BRD, (DE)
5. Müller, Thomas, Alter Postplatz 17, 88400 Biberach, BRD, (DE)
6. Weisenberger, Johannes, Haydnweg 5, 88400 Biberach, BRD, (DE)
7. Guth, Brian, Am Schlegelberg 24, 88447 Warthausen, BRD, (DE)

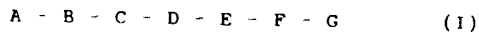
(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Karboksyylihappojohdannaiset, näitä yhdisteitä sisältävät lääkkeet ja menetelmiä niiden valmistamiseksi
Karboxylsydraderivat, läkemedel innehållande dessa föreningar samt förfaranden för deras framställning

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksinnön kohteena on menetelmä valmistaa karboksyylihappojohdannaisia, joiden kaava (I) on



jossa A on ainakin yhden aminoryhmän sisältävä ryhmä, B on 6-jäseninen mahdollisesti substituoitu aromaatti, joka voi sisältää yhden tai kaksi typpiä, C on 1,4-sykloheksyleeni, jossa >CH-yksikkö 1- ja/tai 4-asemassa voi olla korvattu tyrellä, tai metyleeni 5-asemassa ja/tai 2-asemassa on korvattu -NR₃, jolloin näin saadussa renkaassa typen viereinen metyleeni voi olla korvattu karbonyylilla, tai 3,4-dehydro-1,4-piperidinyleeni, jolloin R₃ on vety, alkyyli tai fenyylialkyyli, D on metyleeni, etyleeni, karbonyyli- tai metyleenikarbonyyli tai -NR₃-CO-X, jossa X on alkyleeni tai 1,4-sykloheksyleeni, E on 1,4-sykloheksyleeni tai 1,4-sykloheks-3-enyleeni, tai -NR₄, jossa R₄ on vety tai mahdollisesti substituoitu alkyyli, F on alkyleeni tai sidos ja G substituoitu karbonyyli,

fosfono, O-alkyylifosfono-, tetratsol-5-yyli- tai R₆CO-O-CHR₂-O-CO, jossa R₆ on alkyyli, sykloalkyyli tai sykloalkoksi, alkoksi, fenyyli, fenyylialkyyli tai fenyylialkoksi,

niiden tautomeereja, niiden stereoisomeereja, seoksia ja niiden additiosuoloja.

Uppfinning avser ett förfarande för framställning av karboxylsyra-derivat med formeln (I) där A är åtminstone en amino-grupp innehållande grupp, B är en 6-ledad eventuellt substituerad aroma, som innehåller en eller två kväveatomer, C är 1,4-cyklohexylen, där en >CH-enhet i 1- och/eller 4-ställning kan vara ersatt med kväve, eller metylen i 5-ställning och/eller 2-ställning är ersatt med -NR₃-grupp, varvid i en så erhållen ring kväveatom närliggande metylen kan vara ersatt med karbonyl, eller 3,4-dehydro-1,4-piperidinylen, varvid R₃ är väte, alkyl eller fenylalkyl, D är metylen, etylen, karbonyl- eller metylenkarbonyl, eller -NR₃-CO-X, där X är alkylen eller 1,4-cyklohexylen, E är 1,4-cyklohexylen eller 1,4-cyklohex-3-enylen, eller -NR₄, där R₄ är väte eller eventuellt substituerad alkyl, F är alkylen eller en bindning och G är substituerad karbonyl, fosfono, O-alkyl-fosfono, tetrazol-5-yl eller R₆CO-O-CHR₂-O-CO, där R₆ är alkyl, cykloalkyl eller cykloalkoxi, alkoxi, fenyl, fenylalkyl eller fenylalkoxi, deras tautomerer, deras stereoisomerer, deras blandningar och deras additions-salter.