



PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

SUOMI—FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11)(21) Patentihakemus—Patentansökan 870546
(51) Kv.lk.⁴/Int.cl.⁴ C 07 D 265/36, 498/04
(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 10.02.87
(23) Alkupäivä—Löpdag
(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 12.08.87
(86) Kv. hakemus—Int.ansökan
(30) Etuoikeus—Prioritet 11.02.86 JP 28720/86
15.04.86 JP 87503/86

(71) Hakija/Sökande: *Takeda Chemical Industries, Ltd.*, 27, Doshomachi 2-chome, Higashi-ku, Osaka, Japani

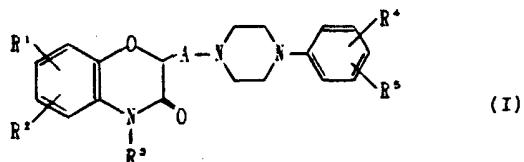
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Meguro, Kanji 2. Nishikawa, Kohei

(74) Asiamies/Ombud: Borenius

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: 1,4-bents-oksatsiinijohdannaiset, niiden valmistus ja käyttö. 1,4-benoxazinderivat, deras framställning och användning.

(57) Tiivistelmä

Keksinnön kohteena on menetelmä uusien yleisen kaavan (I) mukaisten 1,4-bents-oksatsiinijohdannaisien ja niiden hoppoadditiosuoloiden valmistamiseksi

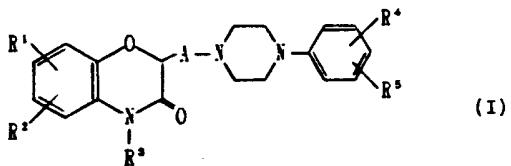


jossa R¹ ja R² toisistaan riippumatta edustavat vetyä, halogeniatomia, nitro-ryhmää, valinnaisesti substituoitua alempaa alkyyliiryhmää, valinnaisesti substituoitua aminoryhmää, valinnaisesti substituoitua hydroksyliiryhmää, alempaa alkoksikarbonyliiryhmää, tai R¹ ja R² yhdessä tarkoittavat rengasta, jota edustaa kaava —{CH₂}_m (jossa m tarkoittaa kokonaislukua 3...5) tai kaava —O—{CH₂}_n—O— (jossa n tarkoittaa kokonaislukua 1...3), R³ tarkoittaa vetyä tai alempaa alkyyliiryhmää, R⁴ ja R⁵ toisistaan riippumatta tarkoittavat vetyä, halogeniatomia, valinnaisesti substituoitua alempaa alkyyliiryhmää tai valinnaisesti substituoitua hydroksyliiryhmää, ja A tarkoittaa alkyleeniryhmää.

Uudet yhdisteet ovat käytökelpoisia ennaltaehkäisevinä tai terapeutisina lääkkeinä mm. korkeasta verenpaineesta ja verettömyydestä johtuvia sairauksia vastaan.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser förfarande för framställning av nya 1,4-benoxazinderivat med den allmänna formeln (I) samt deras syraadditionssalter



där R¹ och R² oberoende av varandra betecknar väte, en halogenatom, en nitrogrupp, en valbart substituerad lägre alkylgrupp, en valbart substituerad aminogrupp, en valbart substituerad hydroxylgrupp, en lägre alkoxikarbonylgrupp, eller R¹ och R² bildar tillsammans en ring som representeras av formeln $\text{-(CH}_2\text{)}_m\text{-}$ (där m betecknar ett helt tal mellan 3 och 5) eller formeln $\text{-O-}(\text{CH}_2)_n\text{-O-}$ (där n betecknar ett helt tal mellan 1 och 3), R³ betecknar väte eller en lägre alkylgrupp, R⁴ och R⁵ betecknar oberoende av varandra väte, en halogenatom, en valbart substituerad hydroxylgrupp, och A betecknar en alkylgrupp.

De nya föreningarna är användbara bl.a. som profylaktiska och terapeutiska läkemedel mot sjukdomar som beror av hypertension och ischemi.