



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

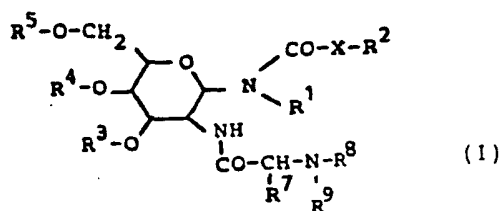
PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus-Patentansökan	862619
(51) Kv.lk./Int.Cl. ⁴ C 07 H 5/06, 15/12	
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag	18.06.86
(23) Aikupäivä-Löpdag	
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig	21.12.86
(86) Kv. hakemus-Int. ansökan	
	20.06.85 DE P 3521994.7
(30) Etuoikeus-Prioritet	

- (71) Hakija/Sökande: Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, Saksa-BRD
- (72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Lockhoff, Oswald 2. Hayauchi, Yutaka 3. Stadler, Peter 4. Stuenkel, Klaus Georg 5. Strelssle, Gert 6. Paessens, Arnold 7. Klimetzek, Volker 8. Zeller, Hans-Joachim 9. Metzger, Karl Georg 10. Kroll, Hein-Peter 11. Brunner, Helmut 12. Schaller, Klaus
- (74) Asiamies/Ombud: Kolster
- (54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: N-(2-aminoasyyliamido-2-desoksi -heksosyyli)-amideja, karbamaatteja ja -karbamideja, menetelmä niiden valmistamiseksi samoin kuin niiden käyttö lääkeaineissa. N-(2-aminoacylamido-2-desoksi-hexocyl) -amider, -karbamater och -karbamider, förfarande för deras framställning samt deras användning i läkemedel.

(57) Tiivistelmä

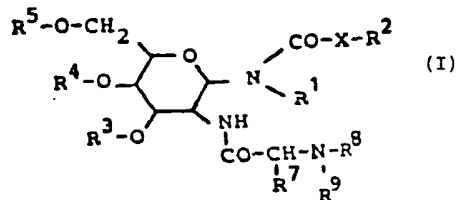
Keksintö koskee uusia N-glykosyyliamideja, N-glykosyylikarbamideja ja N-glykosyylikarbamaatteja, joilla on yleinen kaava I



jossa R¹ on H tai alkyylä; X on -CH₂-, -O- tai -NH-; R² on H tai alkyylä; R³, R⁴ ja R⁵ ovat kukin H tai asyyli; R⁷ tarkoittaa vetyä, C₁-C₇-alkyyliä; hydroksimetyyliä, 1-hydroksietyyliä, merkaptometyyliä, 2-(metyylitio)-etyyliä, 3-aminopropyliä, 3-ureidopropyliä, 3-guanidyylipropyliä, 4-aminobutyliä, karboksietyyliä, karbamoyylimetyyliä, 2-karboksietyyliä, 2-karbamoyylietyyliä, bentsyyliä, 4-hydroksibentsyyliä, 3-indolyylimetyyliä tai 4-imidatsolyylimetyyliä; R⁸ on H tai CH₃ ja R⁹ tarkoittaa vetyä, metyyliä, asetyyliä, bentsoyyliä, triklooriasetyyliä, trifluoriasetyyliä, metoksikarbonyyliä, t-butyylisikarbonyyliä tai bentsyylioksikarbonyyliä ja R⁷ ja R⁸ voivat yhdessä tarkoittaa tähdettä -CH₂-CH₂-CH₂-, myös L- tai R-muodossa tai mahdollisesti sisäisen, farmaseuttisesti käyttökelpoisen suolansa muodossa, sekä niiden valmistusta. Kaavan I mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia lääkeaineina.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser nya N-glykosylamider, N-glykosylkarbamider och N-glykosylkarbamater med den allmänna formeln I,



vari R^1 är H eller alkyl; X är $-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-$ eller $-\text{NH}-$; R^2 är H eller alkyl; R^3 , R^4 och R^5 är var och en H eller acyl; R^7 betecknar väte, C_{1-7} -alkyl; hydroximetyl, 1-hydroxietyl, merkaptometyl, 2-(metyltio)-etyl, 3-aminopropyl, 3-ureidopropyl, 3-guanidylpropyl, 4-aminobutyl, karboximetyl, karbamoylmetyl, 2-karboxietyl, 2-karbamoyletyl, bensyl, 4-hydroxibensyl, 3-indolylmetyl eller 4-imidazolylmetyl; R^8 är H eller CH_3 och R^9 betecknar väte, metyl, acetyl, bensoyl, trikloracetyl, trifluoracetyl, metoxikarbonyl, t-butyloxikarbonyl eller bentyloxikarbonyl, och R^7 och R^8 kan tillsammans beteckna resten $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, även i L- eller R-form eller eventuellt i inre, farmaceutiskt användbar saltform. Föreningarna med formeln I är användbara som läkemedel.