



PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN  
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

SUOMI—FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus—Patentansökan 840955

(51) Kv.Ik.<sup>3</sup>/Int.Cl.<sup>3</sup> C 07 D 401/12, 211/90

(22) Hakemispäivä—Ansökningsdag 8.3.84

(23) Alkupäivä—Löpdag

(41) Tullut julkiseksi—Blivit offentlig 11.9.84

(86) Kv. hakemus—Int. ansökan

(30) Etuoikeus—Prioritet 10.3.83 GB 8306666

(71) Hakija/Sökande: Pfizer Corporation, Calle 15 1/2, Avenida Santa Isabel, Colon, Panama

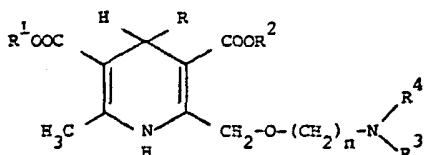
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Alker, David 2. Cross, Peter Edward 3. Campbell, Simon Fraser

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Anti-iskeemiset ja antihypertensiiviset dihydropyridiinit. Anti-iskemiska och antihypertensiva dihydropyridiner.

(57) Tiivistelmä

Keksinnön kohteena ovat anti-iskeemiset ja antihypertensiiviset 1,4-dihydropyridinijohdannaiset, joilla on kaava I,

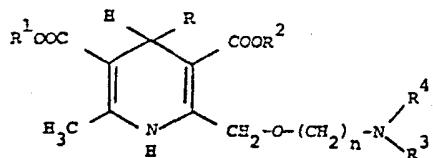


jossa R on aryli tai heteroaryyli; R<sup>1</sup> ja R<sup>2</sup> kumpikin on C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli tai 2-metoksietyyli; n on 2, 3 tai 4; R<sup>3</sup> on H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli) tai CH<sub>2</sub>CN; ja R<sup>4</sup> on ryhmä, jolla on kaava COR<sup>5</sup>, CSR<sup>5</sup>, C(=NR<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> tai SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, joissa R<sup>5</sup> on C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyyli, NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sykloalkyyli), N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli)<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), NHCH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NHNH<sub>2</sub>, NHNHC<sub>2</sub>O<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), NH-aryyli, NHCO-aryyli tai heterosyklinen, NH-heterosyklinen tai NHC0-heterosyklinen ryhmä, tai kun R<sup>4</sup> on C(=O)R<sup>5</sup>, R<sup>5</sup> voi olla H tai CF<sub>3</sub>; R<sup>6</sup> on H, CN, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), SO<sub>2</sub>-aryyli, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli)<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> tai aryyli; ja R<sup>7</sup> on NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), NHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli), NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli)<sub>2</sub>, jossa m on 2-4, tai NH-heterosyklinen ryhmä; ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttyät hoppoadditiosuolat sekä näiden yhdisteiden valmistus.

Jatkuu seuraavalla sivulla  
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

Uppfinningen hänför sig till anti-ischämiska och antihypertensiva 1,4-dihydropyridinderivat med formeln I



vari R är aryl eller heteroaryl; R<sup>1</sup> och R<sup>2</sup> är vardera C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl eller 2-metoxietyl; n är 2, 3 eller 4; R<sup>3</sup> är H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl) eller CH<sub>2</sub>CN; och R<sup>4</sup> är en grupp med formeln COR<sup>5</sup>, CSR<sup>5</sup>, C(=NR<sup>6</sup>)R<sup>7</sup> eller SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, vari R<sup>5</sup> är C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), NH(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cykloalkyl), N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), NHCH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>, NHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>H, NH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NHNH<sub>2</sub>, NHHNCO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), NH-aryl, NHCO-aryl eller en heterocyklisk, NH-heterocyklisk eller NHCO-heterocyklisk grupp, eller då R<sup>4</sup> är C(=O)R<sup>5</sup>, kan R<sup>5</sup> vara H eller CF<sub>3</sub>; R<sup>6</sup> är H, CN, CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), CO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), SO<sub>2</sub>-aryl, SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> eller aryl; och R<sup>7</sup> är NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), NHCO(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl), NH(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)<sub>2</sub>, vari m är 2-4, eller en NH-heterocyklisk grupp, och till deras farmaceutiskt godtagbara syraadditionssalt, samt till framställningen av dessa föreningar.