

Title (en)  
NOVEL PRODRUG DERIVATIVES OF BIOLOGICALLY ACTIVE AGENTS CONTAINING HYDROXYL GROUPS OR NH-ACIDIC GROUPS.

Title (de)  
VORPRODUKTE VON DERIVATEN VON BIOLOGISCH AKTIVEN MITTELN, DIE HYDROXYLGRUPPEN ODER NH-SAURE GRUPPEN ENTHALTEN.

Title (fr)  
NOUVEAUX DERIVES PROMEDICAMENTEUX D'AGENTS BIOLOGIQUEMENT ACTIFS CONTENANT DES GROUPES HYDROXYLE OU DES GROUPES A FONCTION ACIDE NH.

Publication  
**EP 0454773 A1 19911106 (EN)**

Application  
**EP 90902624 A 19900119**

Priority  
DK 24089 A 19890120

Abstract (en)  
[origin: WO9008128A1] Compounds of formula (I), wherein D represents the dehydrogenated residue of a hydroxyl group-containing drug or the dehydrogenated residue of an NH-acidic group-containing drug; the substituents in the phenyl ring alpha and beta are in either meta- or para-position to each other; and the phenyl ring additionally may be substituted; m is an integer of 0 or 1; p is an integer of 0 or 1; n is an integer from 1 to 4; R1 is selected from the group consisting of hydrogen, alkyl, aryl, aralkyl, a group having the formula -COOR5, wherein R5 is an alkyl or aralkyl group, or a carbamoyl group of the formula -CONR6R7, wherein R6 and R7 are the same or different and are hydrogen, an alkyl group, or together with the adjacent nitrogen atom form a 4-, 5-, 6-, or 7-membered heterocyclic ring; R2 is hydrogen or an alkyl group; R3 and R4 are the same or different and are hydrogen, or optionally substituted alkyl, aralkyl, alkenyl or cycloalkyl; or R3 and R4 are combined so that -NR3R4 forms an optionally substituted 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocyclic ring, which in addition to the nitrogen atom may contain one or two further heteroatoms selected from nitrogen, oxygen, and sulfur; with the proviso that m is 0 when D represents the dehydrogenated residue of a hydroxyl group-containing drug and m is 1 when D represents the dehydrogenated residue of an NH-acidic group-containing drug; and the pharmaceutically acceptable acid addition salts or quaternary ammonium salts thereof.

Abstract (fr)  
La présente invention se rapporte à des composés représentés par la formule (I); où D représente le résidu déshydrogéné d'un médicament contenant des groupes hydroxyle ou le résidu hydrogéné d'un médicament contenant des groupes à fonction acide NH; les substituants présents dans le noyau phényle alpha et beta se trouvent soit en position méta- ou para- l'un par rapport à l'autre; et le noyau phényle peut en outre être substitué; m est égal au nombre entier 0 ou 1, p est égal au nombre entier 0 ou 1; n représente un nombre entier compris entre 1 et 4; R1 est choisi dans le groupe composé d'un hydrogène, d'un alkyle, d'un aryle, d'un aralkyle, d'un groupe ayant la formule -COOR5 où R5 représente un groupe alkyle ou aralkyle, ou d'un groupe carbamoyl ayant la formule -CONR6R7, où R6 et R7 sont identiques ou différents et représentent un hydrogène, un groupe alkyle ou forment ensemble, avec l'atome d'azote adjacent, un noyau hétérocyclique à 4, 5, 6 ou 7 éléments; R2 représente un hydrogène ou un groupe alkyle; R3 et R4 sont identiques ou différents et représentent un hydrogène ou un alkyle, un aralkyle, un alkényle ou un cycloalkyle éventuellement substitués; ou R3 et R4 sont combinés de sorte que -NR3R4 forme un noyau hétérocyclique à 4, 5, 6 ou 7 éléments éventuellement substitués, qui, en plus de l'atome d'azote, peut contenir un ou deux autres hétéroatomes choisis parmi l'azote, l'oxygène et le soufre; à condition que m soit égal à 0 lorsque D représente le résidu déshydrogéné d'un médicament contenant des groupes hydroxyle, et que m soit égal à 1 lorsque D représente le résidu déshydrogéné d'un médicament contenant des groupes à fonction acide NH; ainsi qu'aux sels d'addition d'acide ou aux sels d'ammonium quaternaire pharmaceutiquement acceptables desdits composés.

IPC 1-7  
**A61K 31/00; C07C 229/38**

IPC 8 full level  
**A61K 31/16** (2006.01); **A61K 31/215** (2006.01); **A61K 31/24** (2006.01); **A61K 31/495** (2006.01); **A61K 31/505** (2006.01); **A61K 31/535** (2006.01); **A61K 31/5375** (2006.01); **A61K 47/48** (2006.01); **C07C 229/38** (2006.01); **C07C 233/18** (2006.01); **C07C 233/25** (2006.01); **C07C 235/06** (2006.01); **C07C 271/22** (2006.01); **C07D 233/06** (2006.01); **C07D 233/60** (2006.01); **C07D 233/74** (2006.01); **C07D 233/92** (2006.01); **C07D 263/58** (2006.01); **C07D 285/135** (2006.01); **C07D 295/08** (2006.01); **C07D 295/10** (2006.01); **C07D 295/155** (2006.01); **C07D 473/06** (2006.01); **C07D 473/08** (2006.01); **C07D 473/18** (2006.01); **C07D 487/04** (2006.01); **C07H 17/08** (2006.01); **C07H 19/06** (2006.01); **C07H 19/16** (2006.01); **C07J 1/00** (2006.01); **C07J 5/00** (2006.01); **C07J 41/00** (2006.01); **C07J 43/00** (2006.01); **C07D 285/12** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**C07C 229/38** (2013.01); **C07C 233/18** (2013.01); **C07C 233/25** (2013.01); **C07C 235/06** (2013.01); **C07C 271/22** (2013.01); **C07D 233/74** (2013.01); **C07D 233/92** (2013.01); **C07D 263/58** (2013.01); **C07D 285/135** (2013.01); **C07D 295/155** (2013.01); **C07D 473/06** (2013.01); **C07D 473/08** (2013.01); **C07D 473/18** (2013.01); **C07D 487/04** (2013.01); **C07H 17/08** (2013.01); **C07H 19/06** (2013.01); **C07H 19/16** (2013.01); **C07J 1/007** (2013.01); **C07J 5/0053** (2013.01); **C07J 41/005** (2013.01); **C07J 43/003** (2013.01)

Citation (search report)  
See references of WO 9008128A1

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE DK ES FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9008128 A1 19900726**; AU 5032390 A 19900813; CA 2045591 A1 19900721; DK 24089 D0 19890120; EP 0454773 A1 19911106; JP H04502918 A 19920528

DOCDB simple family (application)  
**DK 9000020 W 19900119**; AU 5032390 A 19900119; CA 2045591 A 19900119; DK 24089 A 19890120; EP 90902624 A 19900119; JP 50255390 A 19900119