

Title (en)

DIPHENYLSULPHOXIMINE MUSCARINIC RECEPTOR ANTAGONISTS.

Title (de)

DIPHENYLSULFOXIME ALS MUSCARINREZEPTORANTAGONISTEN.

Title (fr)

ANTAGONISTES DE RECEPTEURS MUSCARINIQUES A BASE DE DIPHENYLSULPHOXIMINE.

Publication

EP 0509005 A1 19921021 (EN)

Application

EP 91901475 A 19901211

Priority

GB 9000303 A 19900106

Abstract (en)

[origin: WO9110648A1] Compounds of formula (I), wherein R and R<1> are H or C1-C4 alkyl; and X is a group of formulae (II) or (III), wherein either R<2> is H or C1-C4 alkyl and R<3> is C1-C4 alkyl, or R<2> and R<3> represent -(CH₂)_r- wherein r is from 2 to 5; R<4> is C1-C4 alkyl; X<1> is a direct link, O or S; R<5> is mono or disubstituted phenyl wherein the substituents are H, halo, C1-C4 alkyl, C1-C4 alkoxy, -(CH₂)_sOH, -(CH₂)_sNR<8>R<9>, -CONR<10>R<11>, -SO₂NH₂ or -OCO(C1-C4 alkyl), or adjacent substituents may form a fused ring; or R<5> is thieryl, pyridinyl or pyrazinyl; R<8> and R<9> are H or C1-C4 alkyl, or R<8> is hydrogen and R<9> is -SO₂(C1-C4 alkyl), -CONR<10>R<11>, -CO(C1-C4 alkyl) or -SO₂NH₂; R<10> and R<11> are hydrogen or C1-C4 alkyl; m is 1, 2 or 3; n is 0, 1 or 2; p is 0 or 1; and s is 0, 1 or 2, (with certain provisos); are gastrointestinal and bladder selective muscarinic receptor antagonists of utility for example in irritable bowel syndrome.

Abstract (fr)

On décrit des composés de la formule (I), où R et R1 sont H ou C1-C4 alkyle; et X est un groupe de formule (II) ou (III), soit R2 est H ou C1-C4 alkyle et R3 est C1-C4 alkyle, soit R2 et R3 représente -(CH₂)_r- où r est de 2 à 5; R4 est C1-C4 alkyle; X1 est une liaison directe, O ou S; R5 est phényle mono ou disubstitué, où les substituants sont H, halo, C1-C4 alkyle, C1-C4 alkoxy, -(CH₂)_sOH, -(CH₂)_sNR8R9, -CONR10R11, -SO₂NH₂ ou -OCO(C1-C4 alkyle), ou des substituants adjacents peuvent former un anneau fusionné; ou R5 est thiéryle, pyridinyle ou pyrazinyle; R8 et R9 sont H ou C1-C4 alkyle, ou R8 est hydrogène et R9 est -SO₂(C1-C4 alkyle), -CONR10R11, -CO(C1-C4 alkyle) ou -SO₂NH₂; R10 et R11 sont hydrogène ou C1-C4 alkyle; m est 1, 2 ou 3; n est 0, 1 ou 2; p est 0 ou 1; et s est 0, 1 ou 2, (sous certaines conditions); lesdits composés sont des antagonistes de récepteurs muscariniques sélectifs du tractus gastrointestinal et de la vessie utiles par exemple dans le traitement du syndrome du côlon irritable.

IPC 1-7

A61K 31/095; A61K 31/40; A61K 31/445; C07C 381/10; C07D 207/09; C07D 207/14; C07D 211/28; C07D 211/56; C07D 405/06

IPC 8 full level

A61K 31/18 (2006.01); **A61K 31/22** (2006.01); **A61K 31/40** (2006.01); **A61K 31/443** (2006.01); **A61K 31/445** (2006.01); **A61P 1/00** (2006.01); **A61P 1/08** (2006.01); **A61P 1/14** (2006.01); **C07C 381/10** (2006.01); **C07D 207/09** (2006.01); **C07D 207/14** (2006.01); **C07D 211/28** (2006.01); **C07D 211/56** (2006.01); **C07D 405/06** (2006.01)

CPC (source: EP)

A61P 1/00 (2017.12); **A61P 1/08** (2017.12); **A61P 1/14** (2017.12); **C07C 381/10** (2013.01); **C07D 207/09** (2013.01); **C07D 207/14** (2013.01); **C07D 211/28** (2013.01); **C07D 211/56** (2013.01); **C07D 405/06** (2013.01)

Citation (search report)

See references of WO 9110648A1

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

WO 9110648 A1 19910725; CA 2072127 A1 19910707; EP 0509005 A1 19921021; FI 922763 A0 19920615; GB 9000303 D0 19900307; IE 910018 A1 19910717; JP H05503094 A 19930527; PT 96418 A 19911015

DOCDB simple family (application)

EP 9002126 W 19901211; CA 2072127 A 19901211; EP 91901475 A 19901211; FI 922763 A 19920615; GB 9000303 A 19900106; IE 1891 A 19910104; JP 50181890 A 19901211; PT 9641891 A 19910104