

Title (en)

PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING FUNCTIONALIZED VINYLZOLES, USE OF THESE VINYLZOLES FOR PRODUCING MEDICAMENTS, THESE VINYLZOLES THEMSELVES AND PROCESS FOR PRODUCING THE SAME.

Title (de)

FUNKTIONALISIERTE VINYLZOLE ENTHALTENDE PHARMAZEUTISCHE PRÄPARATE, VERWENDUNG DIESER VINYLZOLE ZUR HERSTELLUNG VON ARZNEIMITTELN, VINYLZOLE SELBST SOWIE VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG.

Title (fr)

COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES CONTENANT DES VINYLZOLES FONCTIONNALISES, UTILISATION DE CES VINYLZOLES POUR PRODUIRE DES MEDICAMENTS, CES VINYLZOLES PROPREMENT DITS ET LEUR PROCEDE DE PRODUCTION.

Publication

**EP 0550697 A1 19930714 (DE)**

Application

**EP 92900266 A 19911209**

Priority

DE 4039559 A 19901207

Abstract (en)

[origin: WO9210482A1] Pharmaceutical compositions that contain vinylazoles having general formula (I) are disclosed, as well as new vinylazoles having general formula (Ia), contained within the scope of formula (I). In the formulas, X stands for an N atom or for a CH group; Y stands for a S atom or for a CH=CH group; Z stands for a cyano group, a fluorine, chlorine or bromine atom; and R?1 or R?2 stand for a carboxyl group that may be esterified, for a carboxylic acid amide group that may be substituted, for an aldehyde group, for an alkyl or aryl ketone group, for a sulfonamide group that may be substituted, or for a nitrile group; whereas the other group represented by R?1 or R?2 stands for a hydrogen atom, a lower alkyl group or a cycloalkyl group, an aryl group that may be substituted; an aralkyl group, a carboxyl group that may be esterified, a carboxylic acid amide group that may be substituted, an aldehyde group, an alkyl or aryl ketone group or a nitrile group. The compounds having general formulas (I) or (Ia) are effective inhibitors of estrogen biosynthesis (aromatase inhibitors) and are useful for treating diseases mediated by or dependent on estrogens. Processes for producing the compounds having general formula (I) are also disclosed.

Abstract (fr)

L'invention concerne des compositions pharmaceutiques qui contiennent des vinylazoles ayant la formule générale (I), ainsi que des vinylazoles nouveaux ayant la formule générale (Ia) qui sont couverts par la formule générale (I). Dans les formules, X désigne un atome de N ou un groupe CH; Y désigne un atome de S ou un groupe CH=CH; Z désigne un groupe cyano, un atome de fluor, de chlore ou de brome et R1 ou R2 désignent un groupe carboxyle le cas échéant estérifié, un groupe amide d'acide carboxylique le cas échéant substitué, un groupe aldéhyde, ou un groupe cétonique alkyle ou aryle, un groupe sulfonamide le cas échéant substitué ou un groupe nitrile; alors que l'autre groupe désigné par R1 ou R2 est un atome d'hydrogène, un groupe alkyle inférieur ou un groupe cycloalkyle, un groupe aryle éventuellement substitué; un groupe aralkyle; un groupe carboxyle le cas échéant estérifié, un groupe amide d'acide carboxylique le cas échéant substitué, un groupe aldéhyde, un groupe cétonique alkyle ou aryle ou un groupe nitrile. Les composés ayant les formules générales (I) ou (Ia) sont des inhibiteurs efficaces de la biosynthèse d'oestrogènes (inhibiteur de l'aromatase) et sont utiles pour traiter des maladies provoquées par les oestrogènes ou dépendantes de ceux-ci. L'invention concerne également des procédés de production des composés ayant la formule générale (I).

IPC 1-7

**A61K 31/41; C07D 233/60; C07D 233/61; C07D 249/08; C07D 405/04; C07D 405/06; C07D 409/06**

IPC 8 full level

**A61K 31/41 (2006.01); A61K 31/415 (2006.01); A61K 31/4427 (2006.01); A61K 31/443 (2006.01); A61K 31/4433 (2006.01); A61K 31/445 (2006.01); A61K 31/495 (2006.01); A61K 31/535 (2006.01); A61K 31/54 (2006.01); A61K 31/55 (2006.01); A61P 9/08 (2006.01); A61P 9/10 (2006.01); A61P 35/00 (2006.01); C07D 233/60 (2006.01); C07D 233/61 (2006.01); C07D 249/08 (2006.01); C07D 401/06 (2006.01); C07D 403/06 (2006.01); C07D 405/06 (2006.01); C07D 409/06 (2006.01); C07D 409/14 (2006.01); C07D 495/04 (2006.01); C07D 521/00 (2006.01)**

CPC (source: EP KR US)

**A61K 31/41 (2013.01 - EP US); A61P 9/08 (2017.12 - EP); A61P 9/10 (2017.12 - EP); A61P 35/00 (2017.12 - EP); C07D 231/12 (2013.01 - EP US); C07D 233/56 (2013.01 - EP US); C07D 233/61 (2013.01 - KR); C07D 249/08 (2013.01 - EP US)**

Citation (search report)

See references of WO 9210482A1

Designated contracting state (EPC)

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

DOCDB simple family (publication)

**WO 9210482 A1 19920625; AU 660296 B2 19950622; AU 9045491 A 19920708; CA 2097824 A1 19920608; CA 2097824 C 20030408; CN 1064863 A 19920930; CS 369691 A3 19920617; DE 4039559 A1 19920611; EP 0550697 A1 19930714; FI 932572 A0 19930604; FI 932572 A 19930604; HU 9301657 D0 19930928; HU T64036 A 19931129; IE 914259 A1 19920617; IL 100274 A0 19920906; IL 100274 A 19960804; JP H06503818 A 19940428; KR 930703263 A 19931129; NO 304428 B1 19981214; NO 932044 D0 19930604; NO 932044 L 19930604; PT 99714 A 19921030; PT 99714 B 19990531; US 5344834 A 19940906; ZA 919662 B 19920930**

DOCDB simple family (application)

**EP 9102359 W 19911209; AU 9045491 A 19911209; CA 2097824 A 19911209; CN 91112779 A 19911206; CS 369691 A 19911205; DE 4039559 A 19901207; EP 92900266 A 19911209; FI 932572 A 19930604; HU 165793 A 19911209; IE 425991 A 19911209; IL 10027491 A 19911208; JP 50037891 A 19911209; KR 930701698 A 19930605; NO 932044 A 19930604; PT 9971491 A 19911206; US 80263991 A 19911209; ZA 919662 A 19911206**