



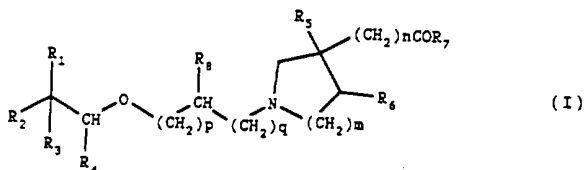
Patentdirektoratet

- |                                     |  |                  |               |
|-------------------------------------|--|------------------|---------------|
| (21) Patentansøgning nr.:           | 6399/89  | (51) Int. Cl. 5: | C 07 D 211/60 |
| (22) Indleveringsdag:....           | 18 dec 1989  |                  | C 07 D 211/78 |
| (24) Løbedag:.....                  | 18 dec 1989  |                  | C 07 D 409/12 |
| (41) Alm. tilgængelig:....          | 21 aug 1990  |                  | C 07 D 409/14 |
| (62) Stamansøgningsnummer:.....     |  |                  |               |
| (86) International ansøgning nr.:   | ...  |                  |               |
| (86) International indleveringsdag: |  |                  |               |
| (85) Videreførselsdag:              |  |                  |               |
| (30) Prioritet:                     | 19 dec 1988 DK 7044/88   |                  |               |
| (71) Ansøger:                       | *Novo-Nordisk A/S, Novo Alle; 2880 Bagsværd, DK                        |                  |               |
| (72) Opfinder:                      | Lars Jacob Stray *Knutzen, Aldersrovej 7; 2950 Vedbæk, DK              |                  |               |
|                                     | Anker Steen *Jørgensen, Oliemøllegade 12, 2. sal; 2100 København Ø, DK |                  |               |
|                                     | Knud Erik *Andersen, Bagsværd Hovedgade 99, 3B; 2880 Bagsværd, DK      |                  |               |
|                                     | Ursula *Sonnewald, Sneppehøj 15; 2750 Ballerup, DK                     |                  |               |
| (74) Fuldmægtig:                    | Peter Houmøller, A/S Ferrosan; Sydmarken 5, 2860, Søborg               |                  |               |

- (54) Nye N-substituerede azaheterocykliske carboxylsyrer  
 (57) Sammendrag

6399-89

N-substituerede azaheterocykliske carboxylsyrer og estre heraf, hvor en ætergruppe udgør en del af N-substituenten har den generelle formel



hvor  $R^1$  og  $R^2$  er ens eller forskellige og hver for sig repræsenterer phenyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyrrolyl eller 3-pyrrolyl, substitueret med en eller flere substituenten valgt blandt følgende atomer eller grupper: H, halogen,  $C_1$ - $C_6$ -alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxy eller cyano;  $R^3$  og  $R^4$  hver for sig er H eller tilsammen danner en binding; m er 1 eller 2 og n er 1 når m er 1 og n er 0 når m er 2;  $R^5$  og  $R^6$  hver for sig er H eller, når m er 2, sammen kan danne en binding, og  $R^7$  er OH eller  $C_1$ - $C_3$ -alkoxy, p er 0, 1 eller 2, q er 0, 1 eller 2,  $R^8$  er H og  $C_{1-4}$ -alkyl, fremstilles ved forskellige fremgangsmåder.

Forbindelserne er potente hæmmere af GABA-optagelse fra den synaptiske kløft og er velegnede ved behandling af bl.a. angst, smerte, epilepsi og muskel- eller bevægelses-sygdomme.