



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 970967

(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6

C 07D 239/34, 213/64, 239/38, 251/22
401/04, 409/04, A 61K 31/44, 31/505, 31/53

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 07.03.97

(24) Alkuperäisyys - Löpdag 08.09.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 07.03.97

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/JP95/01792

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

09.09.94 JP 6-216214 P

(71) Hakija - Sökande

1. Nippon Shinyaku Co., Ltd, 14, Kisshoin Nishinosho Monguchicho, Minami-ku, Kyoto-shi,
Kyoto 601, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Chokai, Shoichi, 16-6, Miharu 2-chome, Shincho, Kameoka-shi, Kyoto 621, Japan, (JP)
2. Ukai, Yojiro, 9-4, Aoyama 5-chome, Otsu-shi, Shiga 520-21, Japan, (JP)
3. Aoki, Tomiyoshi, 705-102, Harimadacho, Moriyama-shi, Shiga 524, Japan, (JP)
4. Ideguchi, Kyoichi, 34-19, Fujimidai, Otsu-shi, Shiga 520, Japan, (JP)

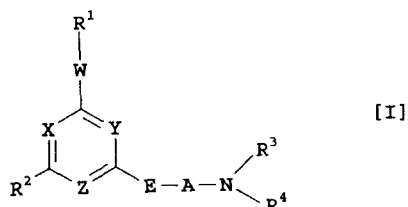
(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy, Ruoholahdenkatu 8, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Heterosyklinen johdannainen ja lääkeaine
Heterocykliskt derivat och läkemedel

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Farmaseuttinen seos, joka sisältää seuraavan yleiskaavan [I] mukaista yhdistettä ta sen suolaa



jossa R^1 on aryyli tai heteroaromaattinen ryhmä. R^2 on vety, alkyyli, alkenyyli, sykloalkyyli, sykloalkyylialkyyli, hydroksialkyyli, halogeenialkyyli, alkoksi, alkyyli-tio, amino, monoalkyyliamino, dialkyyliamino tai fenyyli. R^3 ja R^4 ovat toisistaan riippumatta vety tai alkyyli tai R^3 ja R^4 yhdessä viereisen N-atomin kanssa on 5 - 7-jäseninen syklinen aminoryhmä. A on C_{2-10} -alkyleeni. W on O, S tai $(CH_2)_n$ (jossa CH voi olla substituoitu alkyyllillä; n on kokonaisluku 0, 1 tai 2). X, Y ja Z voivat olla samoja tai erilaisia ja kukin on CH (joka voi olla substituoitu alkyyllillä) tai N. Mukaan ei kuitenkaan lueta tapausta, jossa X, Y ja Z ovat samanaikaisesti CH. Yhdisteellä on erinomainen neuroonaliiketoimintaa inhiboiva aktiivisuus ja on hyödyllinen terapeuttisena lääkkeenä aivoverisuonitauksissa.

Farmaceutiskt blandning, som innehåller en förening med följande allmänna formel [I] eller dess salt, där R^1 är aryl eller en heteroaromatisk grupp, R^2 är väte, alkyl, alkenyl, cykloalkyl, cykloalkylalkyl, hydroksialkyl, halogenalkyl, alkoxi, alkyltio, amino, monoalkylamino, dialkylamino eller fenyl, R^3 och R^4 är oberoende av varandra väte eller alkyl eller R^3 och R^4 tillsammans med bredvidliggande N-atom är en 5 - 7-ledad cyklisk aminogrupp, A är C_{2-10} -alkylen, W är O, S eller $(CH_2)_n$ (där CH kan vara substituerad med alkyl; n är heltallet 0, 1 eller 2). X, Y och Z kan vara lika eller olika och var och en är CH (som kan vara substituerad med alkyl) eller N, dock förutsatt att fallet, där X, Y och Z samtidigt är CH, inte inkluderas. Föreningen enligt uppfinningen har ypperlig neuro-naldöd inhiberande aktivitet och är nyttig som terapeutiskt läkemedel för cerebrovas-kulära sjukdomar.