



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 954017

(51) Kv.1k.6 - Int.cl.6

C 07C 229/64, 323/63, 309/65
C 07D 333/20, C 07C 205/59

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 25.08.95

(24) Alkuperä - Löpdatum 24.02.94

(41) Tulnut julkiseksi - Blivit offentlig 25.08.95

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/SE94/00153

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

26.02.93 SE 9300658 P

(71) Hakija - Sökande

1. Astra Aktiebolag, 151 85 Södertälje, Sverige, (SE)
2. The University of Maryland, 511 West Lombard Street, Baltimore, MD 21202-1691, USA, (US)
3. Cornell Research Foundation Inc., Suite 105, 20 Thornwood Drive, Ithaca, NY 14850, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Björk, Susanna Karin Maria, Bollvägen 69, 151 59 Södertälje, Sverige, (SE)
2. Carpentier, Barry K., 160 Midline Road, Slaterville Springs, NY 14881-9401, USA, (US)
3. Gotthammar, Kristina Birgitta, Björkholmsvägen 188, 132 31 Saltsjö-Boo, Sverige, (SE)
4. Linderberg, Mats Torbjörn, Kämpevägen 29, 151 54 Södertälje, Sverige, (SE)
5. Luthman, Per Johan, Mälargatan 1, 646 00 Gnesta, Sverige, (SE)
6. Persson, Kerstin Margareta Irma, Lillhagavägen 6, 155 31 Nykvarn, Sverige, (SE)
7. Schwarcz, Robert, 6936 Ten Timbers Lane, Baltimore, MD 21209, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Uudet yhdisteet
Nya föreningar

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee 3-hydroksiantraniilihapon 3-HANA:n uusia johdannaisia, joilla on yleinen kaava (I), jossa R^1 ja R^2 ovat samanlaiset tai erilaiset ja ne valitaan H:n, alkyylin, aryylin ja aryylialkyylin piiristä; X ja Y ovat samanlaiset tai erilaiset ja ne valitaan alkoksin, aryylioksin, alkyylin, alkyyliation, aryyliation, fluorialkyylin, halogeenin, syanon, OSO_2CH_3 :n, OSO_2CF_3 :n, OCF_3 :n ja SCF_3 :n piiristä, edellyttäen että sellaista kaava I mukaista yhdistettä, jossa R^1 ja R^2 = H, X = Br ja Y = Me, ei oteta lukuun. Keksintö koskee myös mainittujen johdannaisten farmaseuttisesti hyväksyttävien suoloja sekä välivaiheita valmistusta varten, johdannaisten uusia farmaseuttisia koostumuksia ja sekä niiden käyttöä inhiboimaan entsyymi 3-hydroksiantranilaattioksygenaasi 3-HAO, joka on vastuussa endogeenisen neurotoksiinin, kinoliinihapon QUIN:n tuotosta.

Uppfinningen avser 3-hydroxiantranilsyrans 3-HANAs nya derivat, som har den generella formeln I, i vilken R^1 och R^2 är likadana eller olika och de är valda bland H, alkyl, aryl och arylalkyl; X och Y är likadana eller olika och de är valda från alkoxy, aryl-oxy, alkyl, alkyltio, aryltio, fluoralkyl, halogen, cyano, OSO_2CH_3 , OSO_2CF_3 , OCF_3 och SCF_3 ; under förutsättning att en sådan förening enligt formeln I, i vilken R^1 och R^2 = H, X = Br och Y = Me, inte medräknas. Uppfinningen avser också de nämnda derivatens farmaceutiskt acceptabla salter, metoder och mellansteg för deras preparation, derivatens nya farmaceutiska kompositioner och deras användning, vid inhibering enzymet 3-hydroxiantranilatoxygenas 3-HAO, som är ansvarig för det endogena neurotoxinets, kinolinsyrans QUINS, produktion.

