



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 945562

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

C 07D 271/113, 413/12

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 25.11.94

(24) Alkuperä - Löpdatum 25.11.94

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 27.05.95

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

26.11.93 FR 9314151 P

(71) Hakija - Sökande

1. Synthelabo (Societe Anonyme), 22, avenue Galilee, 92350 Le Plessis-Robinson, France, (FR)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Koenig, Jean-Jacques, 99 avenue du General de Gaulle, 78600 Maisons Laffitte, France, (FR)
2. Jegham, Samir, 65 rue du Lieutenant Colonel Prudhon, 95100 Argenteuil, France, (FR)
3. Puech, Frederic, 2 rue de l'Iser, 92500 Rueil Malmaison, France, (FR)
4. Burnier, Philippe, 8 allée du Bel Air, 78600 Maisons Laffitte, France, (FR)

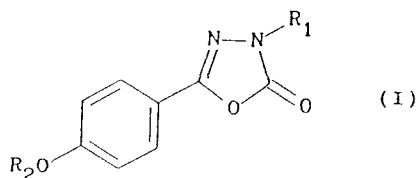
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

1,3,4-oksadiatsol-2(3H)-onijohdannaiset, niiden valmistus ja terapeuttinen käyttö
1,3,4-oxadiazol-2(3H)-onderivat, framställning av dessa och terapeutisk användning av dessa

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee 1,3,4-oksadiatsol-2(3H)-onijohdannaisia, joiden yleinen kaava on:



jossa R₁ esittää joko vetyatomia tai suora-
ketjuista tai haaroittunutta (C₁₋₄)alkyyli-
ryhmää, joka on substituoitu hydroksi-,
fenoksi-, (C₁₋₄)-alkoksi-, (C₁₋₄)tioalkyyli-,
merkpto-, (C₁₋₄)alkoksi-(C₁₋₄)alkoksi-, di-
(C₁₋₄)alkyyliamino- tai N(C₁₋₄)alkyyli-N-
propynyliaminoryhmällä tai (C₃₋₄)alkyny-
liryhmällä ja R₂ esittää suora-
ketjuista tai haaroittunutta (C₁₋₈)-alkyyli-
ryhmää, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ha-
logeeniatomilla ja/tai hydroksiryhmällä,
1-imidatsolyyli- tai 3-tetrahydropyrany-
liryhmällä tai trifluori(C₃₋₅)alkenyyliryh-
mällä, puhtaina enantiomeereinä tai enan-
tiomeerien seoksina, mukaanlukien raseemi-
set seokset, sekä niiden additiosuoloja
farmaseuttisesti hyväksyttävien happojen
kanssa. Keksintö koskee myös yhdisteiden
(I) valmistusta ja niiden terapeuttista
käyttöä.

Uppfinningen avser 1,3,4-oxadiazol-2(3H)-
onderivat med den allmänna formeln (I),
vari R betecknar antingen en väteatom el-
ler en rakkedjad eller förgrenad (C₁₋₄)-
alkylgrupp, substituerad med en hydroxi-,
fenoxi-, (C₁₋₄)alkoxi-, (C₁₋₄)tioalkyl-, mer-
kapto-, (C₁₋₄)alkoxi-(C₁₋₄)alkoxi-, di(C₁₋₄)-
alkylamino- eller N(C₁₋₄)alkyl-N-propynyl-
aminogrupp eller med en (C₃₋₄)alkynylgrupp
och R₂ betecknar en rakkedjad eller förgre-
nad (C₁₋₈)alkylgrupp, substituerad med en
eller flera halogenatomer och/eller med en
hydroxigrupp, en 1-imidazolyl- eller
3-tetrahydropyranylgrupp eller med en tri-
fluor(C₃₋₅)alkenylgrupp, i form av rena
enantiomerer eller enantiomerblandningar,
inklusive de racemiska blandningarna, samt
deras additionssalter med farmaceutiskt
godtagbara syror. Uppfinningen avser även
framställningen av föreningarna (I) och
deras terapeutiska användning.