



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 925737
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07D 403/12, 403/14, 401/12, 401/14
(22) Hakempäivä - Ansökningsdag 17.12.92
(24) Alkuperä - Löpdag 17.12.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 20.06.93
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
19.12.91 US 810661 P 13.10.92 US 959592 P

(71) Hakija - Sökande

1. Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue, New York, N.Y. 10154, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Smith, David W., 7 Silver Birch Lane, Clinton, Conn. 06413, USA, (US)
2. Yocca, Frank D., 38 Tibbals Bridge Road, Madison, Conn. 06443, USA, (US)
3. Yevich, Joseph P., 115 Crest Road, Southington, Conn. 06489, USA, (US)
4. Mattson, Ronald J., 65 Smithfield Avenue, Meriden, Conn. 06450, USA, (US)
5. Williams, Andrew, 10 Dove Lane, Middletown, Conn. 06457, USA, (US)
6. Ruediger, Edward H., 133 St. Charles Road, Greenfield Park, Quebec J4V 2K3, Canada, (CA)
7. Combrink, Keith Dean, 51 Nicholas Road, Wallingford, Conn. 06492, USA, (US)
8. Pearce, Bradley Clyde, 26 Spice Hill Road, East Hampton, Conn. 06424, USA, (US)

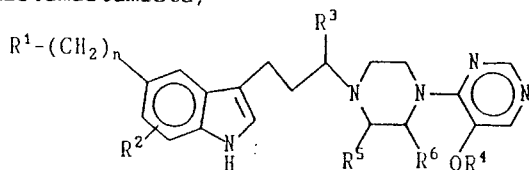
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Menetelmä uusien terapeuttisesti käyttökelpoisten
indol-3-ylialkylpiperatsiini johdannaisten valmistamiseksi
Förfarande för framställning av nya terapeutiskt användbara
indol-3-ylalkylpiperazinderivat

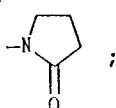
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee uusien kaavan I mukaisten terapeuttisesti käyttökelpoisten indol-3-ylialkylpiperatsiini johdannaisten valmistamista,



I

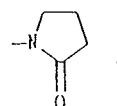
jossa X on -N- tai -CH-; R¹ on vety, halogeeni, alkyyli, alkoksi, R⁷-substituoitu fenyylialkoksi, amino, syaani, hydroksi, nitro, -OCH₂CN, -OCH₂CONR⁷R⁸, -SO₂NR⁷R⁸, -O₂CR⁹, -SO₂R⁹, -O₂CNR⁷R⁸, -COR⁸, -CO₂R⁹, -CONR⁷R⁸, -NR⁷CO₂R⁹, -NR⁷COR⁸, -NR⁷SO₂R⁹ tai



sillä edellytyksellä että ryhmä R¹-(CH₂)_n ei voi olla vety, alkyyli, alkoksi, -CONH₂ tai -NR⁷SO₂R⁹ kun X on -N-; R² on vety, alkyyli, alkoksi, -CO₂R⁹ ja halogeeni; R³, R⁵, R⁶ ja R⁷ tarkoittavat itsenäisesti vetyä tai alkyyliä. R⁴ on alkyyli; R⁸ on vety, alkyyli, R⁷-substituoitu fenyylialkyyli tai trifluorimetyyli; R⁹ tarkoittaa alkyyliä

tai R⁷-substituoitua fenyylialkyyliä; ja n on 0, 1 tai 2.

Uppfinningen avser framställning av nya terapeutiskt användbara indol-3-ylalkylpiperazinderivat med formeln I, vari X är -N- eller -CH-; R¹ är väte, halogen, alkyl, alkoxi, R⁷-substituerad fenylalkoxi, amino, cyano, hydroxi, nitro, -OCH₂CN, -OCH₂CONR⁷R⁸, -SO₂NR⁷R⁸, -O₂CR⁹, -SO₂R⁹, -O₂CNR⁷R⁸, -COR⁸, -CO₂R⁹, -CONR⁷R⁸, -NR⁷CO₂R⁹, -NR⁷COR⁸, -NR⁷SO₂R⁹ eller



under förutsättning, att gruppen R¹-(CH₂)_n icke kan vara väte, alkyl, alkoxi, -CONH₂ eller -NR⁷SO₂R⁹ när X är -N-; R² är väte, alkyl, alkoxi, -CO₂R⁹ och halogen; R³, R⁵, R⁶, och R⁷ betecknar självständigt väte eller alkyl. R⁴ är alkyl; R⁸ är väte, alkyl, R⁷-substituerad fenylalkyl eller trifluormetyl; R⁹ är alkyl eller R⁷-substituerad fenylalkyl; och n är 0, 1 eller 2.