



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 974363

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

C 07D 233/60, A 61K 31/415

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 28.11.1997

(24) Alkupäivä - Löpdag 29.05.1996

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 28.11.1997

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/US96/07833

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

30.05.1995 US 453359 P

(71) Hakija - Sökande

1. Gliatech, Inc., 23420 Commerce Park Drive, Beachwood, OH 44122, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Phillips, James G., 552 Bradley Road, Bay Village, OH 44140, USA, (US)
2. Tedford, Clark E., 1448 Bell Road, South Russel, OH 44020, USA, (US)
3. Khan, Amin Mohammed, 6549 North Park #B-7, Solon, OH 44139, USA, (US)
4. Yates, Stephen L., 455 Sycamore Lane #210, Aurora, OH 44202, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab, Jaakonkatu 3 A, 00100 Helsinki

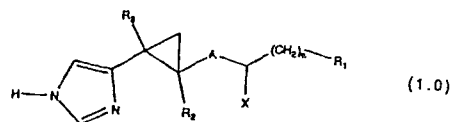
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

2-(1H-4(5)-imidatsoyyli)syklopropyylijohdannaiset
2-(1H-4(5)-imidazoyl)cyklopropylderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee H_3 -histamiinireseptoria-antagonistiaktiivisuutta omaavia yleisen kaavan (1.0) mukaisia yhdisteitä, jossa R_2 on vety tai metyyli- tai etyyli-ryhmä; R_3 on vety tai metyyli- tai etyyli-ryhmä; n on 0, 1, 2, 3, 4, 5 tai 6; ja R_1 on (a) C_{3-6} -sykloalkyyli; (b) fenyyli tai substituoitu fenyyli; (c) alkyyl; (d) heterosykli; (e) dekahydronaftaleeni; tai (f) oktahydroindeeni; niillä ehdoilla, että kun X on H, A voi olla $-CH_2CH_2-$, $-COCH_2-$, $-CONH-$, $-CON(CH_3)-$, $-CH=CH-$, α , $-CH_2NH-$, $-CH_2N(CH_3)-$, $-CH(OH)CH_2-$, $-NHCH_2-$, $-N(CH_3)CH_2-$, $-CH_2O-$, $-CH_2S-$ tai $-NHCOO-$; kun X on NH_2 , $NH(CH_3)$, $N(CH_3)_2$, OH, OCH_3 , CH_3 , SH tai SCH_3 ; A voi olla $-NHCO-$, $-N(CH_3)CO-$, $-NHCH_2-$, $-N(CH_3)CH_2-$, $-CH=CH-$, $-COCH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH(OH)CH_2-$, tai β ; ja kun R_1 ja X ovat yhdessä tyydyttynyt bisyklinen 5,6- tai 6,6-rengasrakenne, X voi olla NH, O tai S. Keksinnön suoja-alaan kuuluvat myös

rakennekaavan (1.0) mukaisten yhdisteiden yksittäiset farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat, hydraatit ja yksittäiset stereoisomeerit samoin kuin niiden seokset. Keksintö koskee myös farmaseuttisia koostumuksia, jotka käsittävät farmaseuttisesti hyväksyttävää väliainetta yhdistelmänä tehokkaan määrän kanssa mainitun kaavan mukaista yhdistettä, ja tapaa hoitaa tiloja, joissa H_3 -histamiinireseptorien antagonialla voi olla terapeuttista merkitystä.

 $-C\equiv C-$ (a) $-C\equiv C-$ (b)