



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 933697

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07D 401/12

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 23.08.93

(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 21.02.92

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 23.08.93

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/EP92/00371

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

25.02.91 GB 9103862 P

(71) Hakija - Sökande

1. Glaxo Group Limited, Glaxo House, Berkeley Avenue, Greenford, Middlesex UB6 0NN, United Kingdom, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Oxford, Alexander William, Glaxo Group Research Limited, Park Road, Ware, Hertfordshire SG12 0DP, United Kingdom, (GB)
2. Whitehead, John William Frank, Glaxo Group Research Limited, Park Road, Ware, Hertfordshire SG12 0DP, United Kingdom, (GB)
3. Knight, John, c/o Glaxo Group Limited, Park Road, Ware, Hertfordshire SG12 0DP, United Kingdom, (GB)

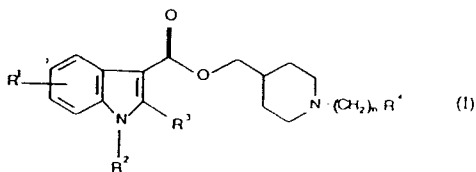
(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

3-Piperidinyylimetyylikarboksylaattisubstituoidut indolit
3-Piperidinylmetylkarboxylatsubstituerade indoler

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Kaavan (I) mukaiset indoliini johdannaiset



jossa R¹ on vety tai halogeeniatomi tai C₁₋₆-alkyyli-, C₁₋₆-alkoksi- tai hydroksiryhmä; R² on vetyatomi tai C₁₋₆-alkyyli-, -CH₂C₂₋₅-alkenyli- tai -CH₂C₂₋₅-alkynyli-ryhmä; R³ on vetyatomi tai C₁₋₆-alkyyli- tai C₁₋₆-alkoksiryhmä; n on 2 tai 3; R⁴ on syaani, hydroksyyli, C₁₋₆-alkoksi, fenoksi, C(O)C₁₋₆-alkyyli, C(O)C₆H₅, -CONR⁵R⁶, -NR⁵COR⁶, -SO₂NR⁵R⁶ tai -NR⁵SO₂R⁶ (jolloin kumpikin ryhmistä R⁵ ja R⁶ on toisesta riippumatta vetyatomi, C₁₋₆-alkyyli- tai fenyyli-ryhmä); ja sen kvaternääriset ammoniumjohdannaiset, piperidiini-N-oksidi ja farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat ja solvaatit; yhdisteet ovat voimakkaita ja spesifisiä 5-hydroksitryptamiinin (5-HT; serotoniini) antagonistejä.

Förfarande för framställning av indol-derivat med formeln (I), där R¹ är väte eller en halogenatom eller C₁₋₆-alkyl-, C₁₋₆-alkoksi- eller hydroxi-grupp; R² är en väteatom eller en C₁₋₆-alkyl-, -CH₂C₂₋₅-alkenyl- eller -CH₂C₂₋₅-alkynylgrupp; R³ är en väteatom eller en C₁₋₆-alkyl- eller C₁₋₆-alkoxigrupp; n är 2 eller 3; R⁴ är cyan, hydroxyl, C₁₋₆-alkoksi, fenoxi, C(O)C₁₋₆-alkyl, C(O)C₆H₅, -CONR⁵R⁶, -NR⁵COR⁶, -SO₂NR⁵R⁶ eller -NR⁵SO₂R⁶ (varvid båda grupperna R⁵ och R⁶ är oberoende av varandra en väteatom, en C₁₋₆-alkyl- eller fenylgrupp); och dess kvaternära ammonium-derivat, piperidin-N-oxider och och farmaceutiskt godtagbara salter och solvat; föreningarna är kraftiga och specifika antagonister till 5-hydroksitryptamin (5-HT; serotonin).