



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 961872
(51) Kv.lk.6 - Int.cl.6
C 07D 261/12, 261/18, 413/04, 413/14, 417/04, 275/03
(22) Hakempäivä - Ansökningsdag 02.05.96
(24) Alkupäivä - Löpdag 02.11.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 03.05.96
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/DK94/00411
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
03.11.93 DK 1243/93 P

(71) Hakija - Sökande

1. H. Lundbeck A/S, 9, Ottiliavej, 2500 Koebenhavn-Valby, Danmark, (DK)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Moltzen Lenz, Sibylle, Howitzvej 46, 2000 Frederiksberg, Danmark, (DK)
2. Falch, Erik, Olgasvej 31, 2950 Vedbaek, Danmark, (DK)
3. Boegesoe, Klaus Peter, Hoersholm Park 16, 2970 Hoersholm, Danmark, (DK)
4. Krogsgaard-Larsen, Povl, Elmevej 25, 3450 Allerød, Danmark, (DK)

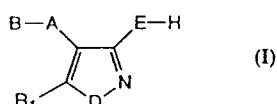
(74) Asiamies - Ombud: Kolster Oy Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

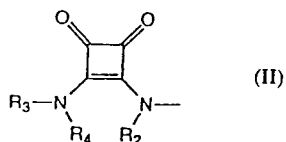
5-aryyli-isoksatsol-4-yyli substituoidut 2-aminokarboksyylihappoyhdisteet
5-aryl isoxazol-4-yl substituerade 2-amino-karboxylsyraforeningar

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksinnön kohteena ovat 2-aminokarboksyylihappoyhdisteet, jotka on substituoitu 5-aryyli-isoksatsol-4-yyllillä tai 5-aryyli-isotiazol-4-yyllillä ja joilla on yleinen kaava (I)



jossa A on sidos tai väliryhmä; B on ryhmä -CH(NR'R'')-COOH, jossa R' ja R'' ovat riippumattomasti vety tai C₁₋₆-alkyyli tai B on kaavan (II)



ryhmä, jossa R₂, R₃ ja R₄ ovat substituentteja; tai R₃ ja R₄ tai R₄ ja R₂ ovat yhdistyneet muodostaen renkaan; E on O, S, COO, (CH₂)_n-COO, O-(CH₂)_n-COO tai S-(CH₂)_n-COO, jossa n on 1 - 6, 5-tetratsolyyli, 5-tetratsolyyli-C₁₋₆-alkyyli, 3-hydroksi-isoksatsolyyli tai 3-hydroksi-isoksatsolyyli-C₁₋₆-alkyyli; D on O tai S; ja R₁ on valinnaisesti substituoitu aryyli tai heteroaryyli; ja nämä yhdisteet ovat ek-sitoivia aminohapporeseptoriligandeja,

jotka ovat hyödyllisiä aivoverettömyyden, Huntingtonin taudin, epileptisten häiriöiden, Parkinsonin taudin, Alzheimerin taudin, skitsofrenian, kivun, masennuksen ja ahdistuksen hoidossa.

Uppfinningen avser 2-aminokarboxylsyraforeningar substituerade med 5-aryl-isoxazol-4-yl eller 5-arylisotiazol-4-yl och har den allmänna formeln (I), vari A är en bindning eller mellangrupp; B är en grupp -CH(NR'R'')-COOH, vari R' och R'' är oberoende väte eller C₁₋₆-alkyl eller B är en grupp med formeln (II), vari R₂, R₃ och R₄ är substituent; eller R₃ och R₄ eller R₄ och R₂ är bundna för att bilda en ring; E är O, S, COO, (CH₂)_n-COO, O-(CH₂)_n-COO eller S-(CH₂)_n-COO, vari n är 1 - 6, 5-tetrazolyl, 5-tetrazolyl-C₁₋₆-alkyl, 3-hydroxiisoxazolyl eller 3-hydroxi-isoxazolyl-C₁₋₆-alkyl; D är O eller S; och R₁ är en valbart substituerad aryl- eller heteroarylgrupp; eller excitatoriska aminosyra receptorligander, vilka är användbara vid behandlingen av hjärnblodfattighet, Huntington sjukdom, epileptiska störningar, Parkinson sjukan, Alzheimer sjukan, schizofreni, smärta, depression och angst.