



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 923267
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07D 471/14 // (C 07D 471/14, 209:00, 221:00, 221:00)
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 16.07.92
(24) Alkuperä - Löpdag 16.07.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 18.01.93
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
17.07.91 US 731691 P

(71) Hakija - Sökande

1. Syntex (U.S.A.) Inc., 3401 Hillview Avenue, Palo Alto, Cal. 94304, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Clark, Robin D., 2025 Columbia Street, Palo Alto, Cal. 94306, USA, (US)
2. Spedding, Michael, 28 Foulis Crescent, Juniper Green, Edinburgh EH14 5BN, Scotland, United Kingdom, (GB)
3. Redfern, William Salisbury, 5 East Claremont Street, Edinburgh EH7 4HT, Scotland, United Kingdom, (GB)

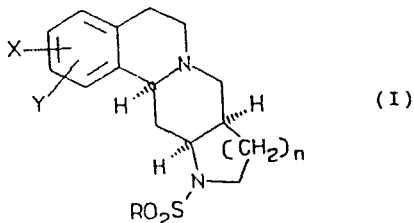
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Dekahydro-8H-isokino(2,1-g) (1,6)naftyridiini- ja dekahydrobenso(a)pyrrolo(2,3-e)kinolitsiini johdannaisia
Dekahydro-8H-isokino(2,1-g) (1,6)naftyridin- och dekahydrobenso(a)pyrrolo(2,3-e)-kinolizinderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee kaavan (I) mukaisten yhdisteiden valmistusta,



jossa X ja Y merkitsevät vetyä, hydroksyyliä, alkyyliä, alkoksyyliä tai halogeenia tai X ja Y muodostavat vierekkäisten hiiliatomien kanssa metyleenidioksi- tai etyleeni-1,2-dioksiryhmän; R on alkyyli, sykloalkyyli, mahdollisesti substituoitu fenyyli tai fenyyli(alempi alkyyli) tai $-ANHSO_2R^1$, jossa A on alkyleeni ja R^1 on alkyyli tai $-NR^2R^3$, jossa R^2 ja R^3 merkitsevät vetyä tai alkyyliä tai ne muodostavat yhdessä sykloalkyyli-ryhmän, ja n on 1 tai 2. Yhdisteet (I) ovat käyttökelpoisia adrenergisten α_2 -reseptorien antagonisteina, erityisesti ääreisalueselektiivisinä adrenergisten α_2 -reseptorien antagonisteina. Keksintö koskee myös yhdisteiden (I) valmistuksessa käyttökelpoisia välituotteita, niiden valmistusta, yhdisteitä (I) sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia ja yhdisteiden (I) terapeuttista käyttöä.

Uppfinningen avser framställning av föreningar med formeln (I), vari X och Y betecknar väte, hydroxi, alkyl, alkoxy eller halogen eller X och Y bildar tillsammans med den närliggande kolatomen en metylendioxi- eller etylen-1,2-dioxigrupp; R är alkyl, cykloalkyl, eventuellt substituerad fenyl eller fenyl(lägre alkyl) eller $-ANHSO_2R^1$, vari A är alkylen och R^1 är alkyl eller $-NR^2R^3$, vari R^2 och R^3 betecknar väte eller alkyl eller de bildar tillsammans en cykloalkylgrupp, och n är 1 eller 2. Föreningarna (I) är användbara som α_2 -adrenoceptorantagonister, speciellt som perifera selektiva α_2 -adrenoceptorantagonister. Uppfinningen avser även vid framställningen av föreningarna (I) användbara mellanprodukter, framställning av dessa, farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller föreningarna (I) och terapeutisk användning av föreningarna (I).