



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 954130

(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6

C 07D 453/02, 471/18, 487/08, A 61K 31/395

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 04.09.95

(24) Alkuperäivä - Löpdag 04.03.94

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 27.10.95

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/DK94/00092

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

05.03.93 US 026943 P

(71) Hakija - Sökande

1. Novo Nordisk A/S, Novo Alle, 2880 Bagsvaerd, Danmark, (DK)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Sauerberg, Per, Syrenvaenget 27, 3520 Farum, Danmark, (DK)

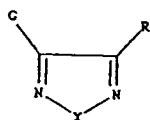
2. Olesen, Preben H., Oerevadsvej 20, 2400 Koebenhavn NV, Danmark, (DK)

(74) Asiamies - Ombud: Berggren Oy Ab

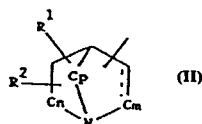
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Heterosykliset yhdisteet ja niiden valmistus ja käyttö
Heterocykliska föreningar och deras framställning och användning

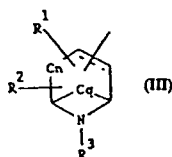
(57) Tiivistelmä - Sammandrag



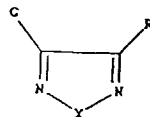
(I)



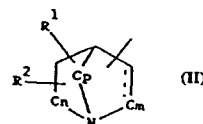
(II)



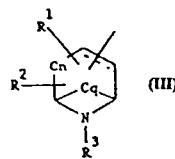
(III)



(I)



(II)



(III)

Keksintö koskee terapeuttisesti aktiivisia atsabisyklisiä yhdisteitä, menetelmää niiden valmistamiseksi, ja yhdisteitä sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia. Uudet yhdisteet ovat käyttökelpoisia nisäkkäiden etuaivojen ja aivoturson kognitiivisen toiminnan stimuloijina ja erityisesti Alzheimerin taudin, vaikeiden kiputilojen ja glaukooman hoidossa. Keksinnön mukaiset uudet yhdisteet ovat kaavan (I) mukaisia heterosyklisiä yhdisteitä, jossa X on happi tai rikki, G on joku seuraavista atsabisyklisistä renkaista (II) tai (III), joissa tiadiatsoli- tai oksadiatsolirengas voi olla kiinnittynyt mihin hyvänsä atsabisyklisen renkaan hiiliatomiin; R¹ ja R² voivat olla läsnä missä hyvänsä asemassa, mukaan lukien tiadiatsoli- tai oksadiatsolirenkaan kiinnityspisteessä.

Uppfinningen avser terapeutiskt aktiva azabicykliska föreningar, ett förfarande för deras framställning, och farmaceutiska saammansättningar innehållande föreningar. De nya föreningarna är användbara såsom stimulanter av kognitiva funktionerna av hjärnans framlob och hippocampus av däggdjur och speciellt vid behandling av Alzheimers sjukdom, svåra smärttillstånd och glaukom. De nya föreningarna enligt uppfinningen är heterocykliska föreningar med formeln (I), där X är syre eller svavel, G är en av följande azabicykliska ringar (II) eller (III), där tiadiazol- eller oxadiazolringen kan vara bunden till vilken kolatom som helst av den azabicykliska ringen; R¹ och R² kan vara i vilken position som helst, inklusive bindningssättet av tiadiazol- eller oxadiazolringen.