[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 955304

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

C 07D 487/04, A 61K 31/495

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 06.11.95

(24) Alkupäivä - Löpdag 28.04.94

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 06.11.95

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/DK94/00170

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

06.05.93 DK 0535/93 P 12.11.93 DK 1287/93 P

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **Jacobsen, Poul**, Moraenevej 2 A, 3550 Slangerup, Danmark, (DK)
2. **Nielsen, Flemming Elmelund**, Fufesoe Parkvej 46, 2830 Virum, Danmark, (DK)
3. **Jeppesen, Lone**, Malmmosevej 121, 2830 Virum, Danmark, (DK)

(74) Asiamies - Ombud: **Berggren Oy Ab**

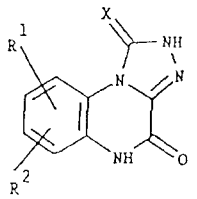
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**(1,2,4)triatsoli(4,3-a)kinoksaliiniyhdisteitä, niiden valmistus ja käyttö**
**(1,2,4)triazolo(4,3-a)kinoxalinföreningar, deras framställning och användning**

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

[1,2,4]triatsoli[4,3-a]kinoksaliinijohdannaisilla, joilla on yleinen kaava (I), jossa toinen ryhmistä $R^1$ ja $R^2$ on 5- tai 6-jäseninen N:ää sisältävä heterosyklinen rengas, joka on mahdollisesti substituoitu, tai fuusioitu rengasjärjestelmä, joka sisältää 5- tai 6-jäsenisen N:ää sisältävän heterosyklisen renkaan, joka on mahdollisesti substituoitu; ja toinen ryhmistä $R^1$ ja $R^2$ on H, alkyyli, alkoksi, halogeeni, $NO_2$, $NH_2$, CN, $CF_3$, $COC_{1-6}$-alkyyli tai $SO_2NR'R''$, jossa R' ja R'' ovat toisistaan riippumatta H tai alkyyli ja X on O tai S; ja näiden farmaseuttisesti hyväksyttävillä suoloilla on affiniteettia AMPA-reseptoreja kohtaan ja ne ovat antagonisteja tämäntyyppisten reseptorien yhteydessä, mikä tekee niistä käyttökelpoisia keskushermoston sairauksien hoidossa ja erityisesti minkä tahansa monen sellaisen indikaation hoidossa, jonka syynä on eksitatoristen aminohappojen yliaktiivisuus.

[1,2,4]triazolo[4,3-a]kinoxalinderivat med den allmänna formeln (I) där en av $R^1$ och $R^2$ är 5- eller 6-ledad, N-innehållande heterocyklisk ring, möjligen substituerad, eller ett fusionerat ringsystem, som innehåller en 5- eller 6-ledad, N-innehållande heterocyklisk ring, möjligen substituerad; och den andra av $R^1$ och $R^2$ är H, alkyl, alkoxi, halogen, $NO_2$, $NH_2$, CN, $CF_3$, $COC_{1-6}$-alkyl eller $SO_2NR'R''$, där R' och R'' är oberoende av varandra H eller alkyl och X är O eller S; och deras farmaceutiskt acceptabla salter har affinitet mot AMPA-receptorer och är antagonistiska ämnen i samband med denna typ av receptorer, vilket gör dem användbara vid behandling av sjukdomar i det centrala nervsystemet, speciellt vid behandling av vilket som helst av de flera indikationer förorsakade av hyperaktivitetet av excitatoriska aminosyror.




(I)