

(FI)

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 971177

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

C 07D 451/02, 209/52, 221/24, 223/14
403/04, 209/44, A 61K 31/395

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 20.03.1997

(24) Alkupäivä - Lõpdaq 23.08.1995

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 20.05.1997

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/GB95/02001

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

21.09.1994 GB 9419024 P

(71) Hakiya - Sökande

1. **John Wyeth & Brother Ltd**, Huntercombe Lane South, Taplow, Maidenhead, Berkshire SL6 0PH, United Kingdom, (GB)
2. **American Home Products Corporation**, Five Giralda Farm, Madison, NJ 07940-0874, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **Cliffe, Ian Anthony**, Priory View, One Pin Lane, Farnham Common, Bucks SL2 3RA, United Kingdom, (GB)
2. **Mansell, Howard Langham**, 142 Lent Green Lane, Bumham, Bucks SL1 7AW, United Kingdom, (GB)
3. **Ward, Terence James**, 2 Northbury Cottages, Castle End Road, Ruscombe, Reading Berks RG10 9XH, United Kingdom, (GB)
4. **Nelson, James Albert**, 7 Decision Way West, Washington Crossing, PA 19877, USA, (US)
5. **Shah, Uresh Shantilal**, 3 Kinglet Drive North, Cranbury, NJ 08512, USA, (US)
6. **Kanzelberger, Mira Ana**, 3604 Wildwood Court, Monmouth Junction, NJ 08852, USA, (US)

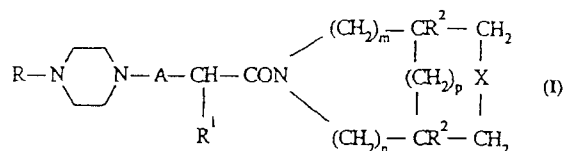
(74) Asiames - Ombud: **Kolster Oy Ab**, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Bisyklisiā karboksiamideja 5-HT_{1A}-antagonisteina
Bicykliska karboxamider som 5HT_{1A}-antagonister

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Bisykkliset karboksiamidit, joiden kaava on
(I),



sekä niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät happeadditiosuolat ovat 5-HT_{1A}:ta sitovia aineita, erityisesti 5-HT₁-antagonisteja, ja niitä voidaan käyttää esimerkiksi ahdistusta poistavina lääkkeinä. Kaavassa X on -CR²=CR²- tai (CR²)_q-; m on 0, 1 tai 2; n on 0, 1 tai 2; p on 0, 1, 2 tai 3 ja q on 0, 1, 2 tai 3; A on alkyleeniketju, jossa on 1 tai 2 hiiliatomia, jotka on valinnaisesti substituoitu yhdellä tai useammalla alemmalla alkyyliryhmällä; R on mono- tai bisyklinen aryyli- tai heteroaryylliradiikaali; R¹ on aryyli- tai aryyli(alempi)alkyyliradiikaali; ja kukin R² on toisistaan riippumatta vety tai alempi alkyyli.

Bicykliska karboxamider med formeln (I) samt deras farmaceutiskt acceptabla syra-additionssalter är 5-HT_{1A}-bindande ämnen, speciellt 5-HT₁-antagonister, och de kan användas till exempel som anxiolytika. X är i formeln -CR²=CR²- eller (CR²)_q-; m är 0, 1 eller 2; n är 0, 1 eller 2; p är 0, 1, 2 eller 3 och q är 0, 1, 2 eller 3; A är en alkylenked med 1 eller 2 kolatomer, som är valfritt substituerad med en eller flera lägre alkylgrupper; R är en mono- eller bicyklisk aryl- eller heteroarylradikal; R¹ är en aryl- eller aryl(lägre)alkylradikal; och varje R¹ är oberoende av varandra väte eller lägre alkyl.