[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 913957

(51) Kv.lk.5 - Int.cl.5

C 07D 413/06, 261/20, 413/12, 413/14, 417/12, 417/14

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 21.08.91

(24) Alkupäivä - Löpdag 21.08.91

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 24.02.92

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

23.08.90 US 571482 P 26.04.91 US 692341 P

(71) Hakija - Sökande

1. **Hoechst-Roussel Pharmaceuticals Incorporated**, Route 202-206 North, Somerville, N.J. 08876, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. **Wettlaufer, David Gordon**, Kronthaler Strasse 26, 6232 Bad Soden am Taunus, BRD, (DE)
2. **Shutske, Gregory Michael**, 21 Coppermine Village, Flemington, N.J. 08822, USA, (US)
3. **Nemoto, Peter Allen**, 33 West Union Avenue, Bound Brook, N.J. 08805, USA, (US)

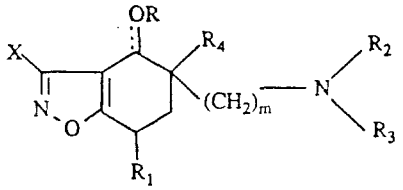
(74) Asiamies - Ombud: **Oy Kolster Ab**

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

6,7-dihydro-3-fenyyli-1,2-bentsisoksatsol-4(5H)-oneja ja -oleja, menetelmä niiden valmistamiseksi ja niiden käyttö lääkkeinä
6,7-dihydro-3-fenyl-1,2-bensisoxazol-4(5H)-oner och -oler, förfarande för framställning av dessa samt användning av dessa som läkemedel

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

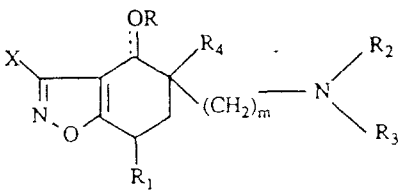
Keksintö koskee 6,7-dihydro-3-fenyyli-1,2-bentsisoksatsol-4(5H)-onien ja -olien valmistusta, joilla on kaava



jossa X on  tai alkyyli;

Y on vety, halogeeni, alkyyli, alkoksi, trifluorimetyyli, nitro tai amino; R on H, kun kyseessä oleva happiatomin ja hiiliatomin välinen sidos on yksinkertainen sidos; muuten katkoviiva merkitsee osaa kaksoissidoksesta happiatomiin; R_1 on vety, alkyyli tai aryylialkyyli; R_2 ja R_3 merkitsevät vetyä, alkyyliä tai aryylialkyyliä, tai R_2 ja R_3 muodostavat yhdessä typpiatomin kanssa mahdollisesti substituoidun heterosyklin; R_4 on vety, alkoksikarbonyyli tai aryylioksikarbonyyli; m on kokonaisluku 1 - 4; ja n on kokonaisluku 1 - 4. Yhdisteet ovat käyttökelpoisia antipsykoottisina aineina ja analgeettisina aineina.

Uppfinningen avser framställning av 6,7-dihydro-3-fenyl-1,2-bensisoxazol-4(5H)-oner och -oler med formeln



vari X är  eller alkyl;

Y är väte, halogen, alkyl, alkoxi, trifluormetyl, nitro eller amino; R är H när bindningen mellan syreatomen och kolatomen i fråga är en enkel bindning; i annat fall betecknar den streckade linjen en del av en dubbelbindning till syreatomen; R_1 är väte, alkyl eller arylalkyl; R_2 och R_3 betecknar väte, alkyl eller arylalkyl, eller R_2 och R_3 bildar tillsammans med kväveatomen en valfritt substituerad heterocykel; R_4 är väte, alkoxikarbonyl eller aryloxikarbonyl; m är ett heltal 1 - 4; och n är ett heltal 1 - 4. Föreningarna är användbara som antipsykotiska och analgetiska medel.