



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	953793
(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6	
C 07D 265/30	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	10.08.95
(24) Alkupäivä - Löpdag	08.02.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	10.08.95
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/JP94/00186
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
10.02.93 JP 5-45691 P	27.09.93 JP 5-240147 P

(71) Hakija - Sökande

1. Yamanouchi Pharmaceutical Co., Ltd, 3-11, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 103, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Fujii, Mitsuo, 33-58, Kabeshinden, Ina-machi, Tsukuba-gun, Ibaraki 300-23, Japan, (JP)
2. Suzuki, Takayuki, 5-9-223, Ninomiya 2-chome, Tsukuba-shi, Ibaraki 305, Japan, (JP)
3. Hayashibe, Satoshi, 43-25-201, Nakagawa 4-chome, Adachi-ku, Tokyo 120, Japan, (JP)
4. Tsukamoto, Shin-ichi, 35-2-202, Kasuga 2-chome, Tsukuba-shi, Ibaraki 305, Japan, (JP)
5. Yatsugi, Shin-ichi, Sanraizuwakaba 302, 8-10, Kamitakatsushinmachi, Tsuchiura-shi, Ibaraki 300, Japan, (JP)
6. Yamaguchi, Tokio, 16-3-402, Ryole 6-chome, Urawa-shi, Saitama 336, Japan, (JP)

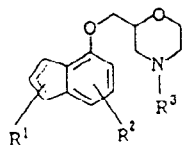
(74) Asiamies - Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Morfoliinijohdannainen  
Morfolinderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee kaavan (I) mukaista morfoliinijohdannaisesta tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa,



(I)

jossa  $R^1$  ja  $R^3$ , jotka voivat olla samat tai erilaisia, ovat kumpikin vetyatomi tai alempi alkyyliryhmä;  $R^2$  on halogeeniatomi; ja pisteiviiva ilmaisee mahdollisen kaksoissidoksen. Näillä yhdisteillä on selektiivistä 5-HT:n vastaanoton estävää aktiivisuutta ja selektiivistä 5-HT<sub>2</sub>-reseptori-antagonistista aktiivisuutta, ja ne ovat käyttökelpoisia terapeuttisena aineena masennuksen, ahdistuneisuuden ja vastavien tilojen hoitoon vähäisemmin sivuvaikutuksin.

Uppfinningen avsert ett morfolinderivat med formeln (I) eller dess farmaceutiskt godtagbart salt, där  $R^1$  och  $R^3$ , som kan vara samma eller olika, är båda en väteatom eller en lägre alkylgrupp;  $R^2$  är en halogenatom; och punktlinjen indikerar en möjlig dubbelbindning. Dessa föreningar har en selektiv, mottagning av 5-HT hindrande aktivitet och selektiv 5-HT<sub>2</sub>-receptorantagonisk aktivitet, och de är användbara såsom ett terapeutikum för depression, ångest och dylika tillstånd med färre biverkningar.