



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 890098
(51) Kv.lk.⁴/Int.Cl.⁴ C 07 D 401/12
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 09.01.89
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 12.07.89
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 11.01.88 US 141852

(71) Hakija/Sökande: *Hoechst-Roussel Pharmaceuticals Incorporated*,
Route 202-206 North, Somerville, N.J., USA

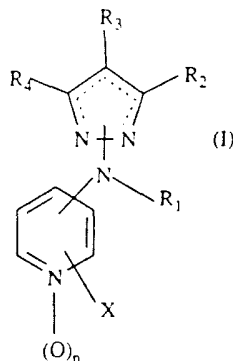
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Effland, Richard Charles 2. Klein, Joseph
Thomas

(74) Asiamies/Ombud: Kolster

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Pyratsoli- ja indatsoli-
pyridiiniamiinit, menetelmä niiden valmistamiseksi ja niiden käyttö
lääkkeinä. Pyrazol- och indazolpyridinaminer, förfarande för deras
framställning och deras användning som läkemedel.

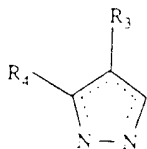
(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee yhdisteitä, joiden kaava on



jossa n on 0 tai 1; R₁ on vety, alempialkyyli, alempialkenyyli, alempialkynyyli, alempi-
alkoksikarbonyylialempialkyyli, alempialkyyliaminokarbonyylialempialkyyli, aminokarbonyyli-
alempialkyyli, aryylialempialkyyli, fenyyl, nitrofenyyli, syaanifenyyli, trifluorimetyyli-
fenyyli, aminofenyyl, alempialkanoyyliaminofenyyl, alempialkoksikarbonyyli, aryylialempi-
alkoksikarbonyyli, arylioksikarbonyyli, alempialkyyliaminokarbonyyli, aryylialempialkyyli-
aminokarbonyyli, aryliaminokarbonyyli, alkanoyyli, aryylialempialkanoyyli, aroyyli, al-
kenoyyli, alkynoyyli tai -R₅-NR'R", jossa R₅ on alempialkyleeni, alempialkenyleeni tai

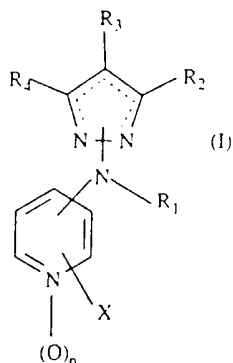
alempialkynyleeni, ja R' ja R" ovat toisistaan riippumatta alempialkyyliiryhmiä tai vaihtoehtoisesti ryhmä -NR'R" on kokonaisuutena 1-pyrrolidinyyli, 1-piperidinyyli, 4-morfolinyyli, 4-alempialkyyli-1-piperatsinyyli tai 4-aryyli-1-piperatsinyyli; R₂ on vety tai alempialkyyli; R₃ ja R₄ ovat toisistaan riippumatta vety tai alempialkyyli tai vaihtoehtoisesti R₃ ja R₄ muodostavat yhdessä ryhmän -CH=CH-CH=CH-, jolloin ryhmästä



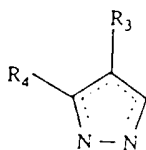
tulee indatsolirengas; ja X on vety, nitro, amino, halogeeni, alempialkanoyyliamino, aryylialempialkanoyyliamino, aroyyliamino, alkyyliamino, aryylialempialkyyliamino, alempialkyyli tai syaani, ja menetelmää niiden valmistamiseksi. Keksinnön mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia kipu- ja masennuslääkkeitä.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser föreningar med formeln:



vari n är 0 eller 1, R¹ är väte, lägre alkyl, lägre alkenyl, lägre alkynyl, lägre alkoxykarbonyl-lägrealkyl, lägre alkylaminokarbonyl-lägrealkyl, aminokarbonyl-lägrealkyl, aryl-lägrealkyl, fenyl, nitrofenyl, cyanfenyl, trifluormetylfenyl, aminofenyl, lägrealkanoylaminofenyl, lägre alkoxykarbonyl, aryl-lägrealkoxykarbonyl, aryloxikarbonyl, lägre alkylaminokarbonyl, aryl-lägrealkylaminokarbonyl, arylaminokarbonyl, alkanoyl, aryl-lägrealkanoyl, aroyl, alkenoyl, alkynoyl eller -R₅-NR'R", vari R₅ är lägre alkylen, lägre alkenylen eller lägre alkynylen, och R' och R" är självständigt lägre alkylgrupper eller alternativt är gruppen -NR'R" i sin helhet 1-pyrrolidinyli, 1-piperidinyli, 4-morfolinyli, 4-lägrealkyl-1-piperazinyli eller 4-aryli-1-piperazinyli; R₂ är väte eller lägre alkyl; R₃ och R₄ är självständigt väte eller lägre alkyl eller alternativt bildar R₃ och R₄ tillsammans gruppen -CH=CH-CH=CH-, varvid gruppen:



kommer att bilda en indazolring; och X är väte, nitro, amino, halogen, lägre alkanoyl-amino, aroylamino, alkylamino, aryl-lägrealkylamino, lägre alkyl eller cyan, och ett förfarande för deras framställning. Föreningarna enligt uppfinningen är användbara som analgetiska och antidepressiva medel.