



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 972129  
(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6  
C 07D 403/12  
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 19.05.97  
(24) Alkupäivä - Löpdag 13.11.95  
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 18.07.97  
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/JP95/02310  
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet  
21.11.94 JP 6-312673 P

(71) Hakija - Sökande

1. Dainippon Pharmaceutical Co., Ltd, 6-8, Dosho-machi 2-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541, Japan, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Kato, Shiro, 6-18, Ebarajicho 2-cho, Sakai-shi, Osaka 593, Japan, (JP)  
2. Hirokawa, Yoshimi, 2266-47, Midorigaoka, Ikoma-shi, Nara 630-02, Japan, (JP)  
3. Yamazaki, Hiroshi, 21-18, Shinbashi-cho, Kadoma-shi, Osaka 571, Japan, (JP)  
4. Morie, Toshiya, 34-9, Higashishinmachi 1-chome, Matsubara-shi, Osaka 580, Japan, (JP)  
5. Yoshida, Naoyuki, 6-15-207, Miikedai 2-cho, Sakai-shi, Osaka 590-01, Japan, (JP)

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

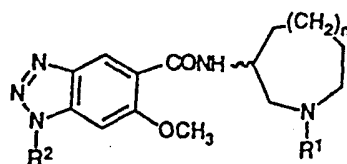
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

6-metoksi-1H-bentsotriatsoli-5-karboksamidijohdannaisia, menetelmä niiden valmistamiseksi ja niitä sisältäviä lääkekoostumuksia  
6-metoksi-1H-bentsotriazol-5-karboxamidderivat, förfarande för framställning av dessa och läkemedelskomposition innehållande densamma

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Käsillä oleva keksintö kohdistuu kaavan (I) mukaiseen 6-metoksi-1H-bentsotriatsoli-5-karboksamidijohdannaiseen tai sen farmakologisesti hyväksyttävään happoadditiosuoloihin, menetelmään näiden valmistamiseksi, kaavan (I) mukaista yhdistettä tai sen farmakologisesti hyväksyttävää happoadditiosuolaa sisältäviin lääkekoostumuksiin ja uuteen välituotteeseen, jossa R<sup>1</sup> on etyyli- tai syklopropyylimetyyli, R<sup>2</sup> on vety, metyyli tai etyyli, n on 1, 2 tai 3, ja aaltoviiva tarkoittaa sitä, että samalla esitetyn sidoksen sisältämän hiiliatomin konfiguraatio on joko raseeminen (RS) tai optisesti aktiivinen (R tai S). Yhdisteellä on erinomaisia sekä antiemeettistä että ruoansulatusta edistävää toimintaa lisääviä vaikutuksia ja sillä on vähemmän keskushermostoa lamaavaa vaikutusta ja tästä syystä johtuen se on hyödyllinen ruoansulatusta parantavana aineena hoidettaessa ja ehkäistäessä useita ruoansulatus toiminnan häiriöitä, jotka liittyvät erilaisten sairauksien hoitoon.

Föreliggande uppfinning avser ett 6-metoksi-1H-bentsotriazol-5-karboxamidderivat med formeln (I) eller dess farmakologiskt acceptabla syraadditionssalter, ett förfarande för framställning av dem, läkemedelskompositioner, som innehåller en förening med formeln (I) eller dess farmakologiskt acceptabla syraadditionssalt, och en ny mellanprodukt, vari R<sup>1</sup> är etyl- eller cyklopropylmetyl, R<sup>2</sup> är väte, metyl eller etyl, n är 1, 2 eller 3 och våglinjen anger, att konfigurationen hos den av våglinjen bundna kolatomen är antingen racemisk (RS) eller optiskt aktiv (R eller S). Föreningen besitter både en utmärkt antiemetisk och digestionsbefrämjande effekt och en reducerad hämmande effekt på det centrala nervsystemet och kan således användas som ett digestionsförbättrande medel vid behandling och profylax av varierande digestionsstörningar i samband med behandling av varierande sjukdomar.



(I)