



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

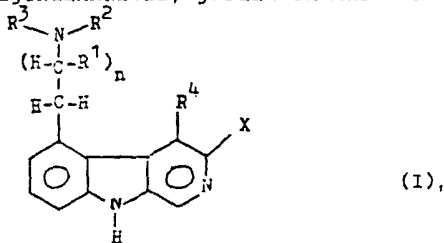
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21) Patenttihakemus-Patentansökan 865234
(51) Kv. lk. 4/Int. cl. 4 C 07 D 471/04
// (C 07 D 471/04, 209:00, 221:00)
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 19.12.86
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 21.06.87
(86) Kv. hakemus-Int.ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 20.12.85 DE P 3545776.7

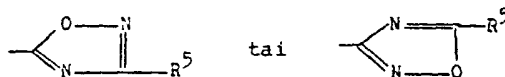
- (71) Hakija/Sökande: *Schering Aktiengesellschaft*, Berlin/Bergkamen;
Muellerstrasse, 170-178, Berlin, Saksa-BRD
- (72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Biere, Helmut 2. Huth, Andreas 3. Rahtz,
Dieter 4. Schmiechen, Ralph 5. Seidelmann, Dieter 6. Stephens,
David Norman
- (74) Asiamies/Ombud: Kolster
- (54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: 5-aminoalkyyli- β -
karboliinijohdannaiset, niiden valmistus ja niiden käyttö lääkkeinä.
5-aminoalkyl- β -karbolinderivat, deras framställning och användning
som läkemedel.

(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee farmaseuttisesti aktiivisia 5-aminoalkyyli-
 β -karboliinijohdannaisia, joilla on kaava I



jossa n on 0 tai 1, R^1 on vety tai alempi alkyyl, R^2 ja R^3
ovat kumpikin vety, mahdollisesti substituoitu alempi alkyyl,
asyyli tai aryyli, tai muodostavat yhdessä typpiätoimin kanssa
5-6-jäsenen heterosyklisen ryhmän, R^4 on vety, alempi alkyyl
tai alempi alkoksialkyyl ja X merkitsee oksadiatsolyyliradikaal-
ia, jolla on kaava

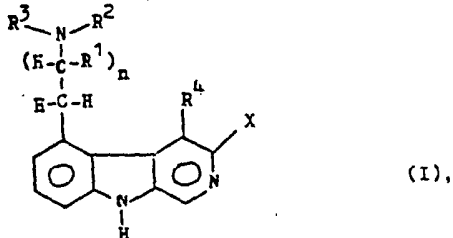


jossa R^5 on vety, alempi alkyyl tai sykloalkyyli, tai ryhmää
 $COOR^6$, jossa R^6 on vety tai alempi alkyyl tai ryhmää $CO-NR^7R^8$,
jossa R^7 ja R^8 ovat kumpikin vety tai mahdollisesti substituoi-
tu alempi alkyyl, asyyli tai aryyli tai muodostavat yhdessä
typpiätoimin kanssa 5-6-jäsenen heterosyklisen ryhmän.

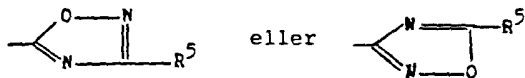
Keksinnön kohteena on myös menetelmä näiden yhdisteiden valmis-
tamiseksi.

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser farmaceutiskt aktiva 5-aminoalkyl- β -karbolin-derivat med formeln I,



vari n är 0 eller 1, R^1 är väte eller lägre alkyl, R^2 och R^3 är vardera väte, eventuellt substituerad lägre alkyl, acyl eller aryl, eller de bildar tillsammans med kväveatomen en 5-6-komponentig heterocyklisk grupp, R^4 är väte, lägre alkyl eller lägre alkoxialkyl och X betecknar en oxadiazolyradikal med formeln:



vari R^5 är väte, lägre alkyl eller cykloalkyl eller gruppen COOR^6 , vari R^6 är väte eller lägre alkyl, eller gruppen $\text{CO-NR}^7\text{R}^8$, vari R^7 och R^8 vardera är väte eller eventuellt dubbtituerad lägre alkyl, acyl eller aryl, eller de bildar tillsammans med kväveatomen en 5-6-komponentig heterocyklisk grupp. Uppfinningen avser även ett förfarande för framställning av dessa föreningar.