



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	921875
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5	
C 07D 417/12, 413/12, 417/14	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	27.04.92
(24) Alkupäivä - Löpdag	27.04.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	30.10.92
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
29.04.91 US 693168 P	

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Hrib, Nicholas J., 2402 Jamestown Common, Somerville, N.J. 08876, USA, (US)
2. Jurcak, John G., 538-36 Street, Union City, N.J. 07087, USA, (US)

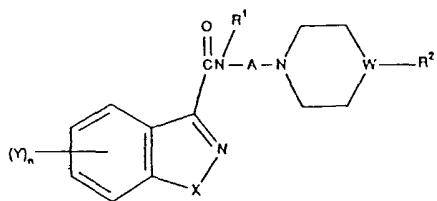
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Menetelmä lääkeaineina käyttökelpoisten bentsisotiatzoli- ja bentsisoksatsoli-3-karboksiamidien valmistamiseksi
Förfarande för framställning av bentsotiazol- och bentsisoxazol-3-karboxamider, vilka är användbara som läkemedel

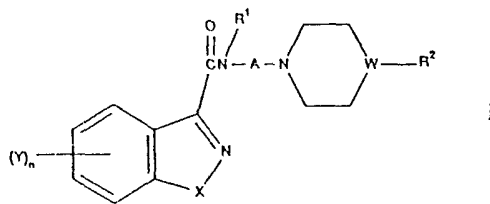
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämän keksinnön kohteena on menetelmä bentsisotiatzoli- ja bentsisoksatsoli-3-karboksiamidien valmistamiseksi, joilla on kaava I



jossa R¹ on vety tai alempi alkyyli; R² on alempi alkyyli tai fenyyli-, bentsyyli-, bentsisoksatsolyyli-, 2-okso-1-bentsimidatsolinyyli-, bentsyyli-, bentsisotiatzolyyli-, pyrimidinyyli- tai bentso[b]tiofenyyli-ryhmä, joka voi olla substituoitu alkyyllillä, alkoksilla, hydroksilla, halogeenilla ja/tai trifluorimetyyllillä; A on alempi alkyleeni tai ryhmä -CHR⁴CH=CHCHR⁴- tai -CHR⁴C≡CHR⁴-, joissa R⁴ on vety tai alempi alkyyli; X on O tai S; W on N tai CH; Y on vety, alempi alkyyli, alempi alkoksi, hydroksi, halogeeni tai trifluorimetyyli; sekä niiden geometristen ja optisten isomeerien ja farmaseuttisesti hyväksyttävien suolojen valmistamiseksi. Nämä yhdisteet ovat käyttökelpoisia psykoosien hoidossa.

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av bentsotiazol- och bentsisoxazol-3-karboxiamider med formeln I



vari R¹ är väte eller lägre alkyl; R² är lägre alkyl eller en fenyl-, bensoyl-, bentsisoxazolyl-, 2-oxo-1-bensimidazolinyli-, bensyl-, bentsotiazolyl-, pyrimidinyl- eller benso[b]tiofenylgrupp, som kan vara substituerad med alkyl, alkoxi, hydroxi, halogen och/eller trifluormetyl; A är lägre alkyleen eller en grupp -CHR⁴CH=CHCHR⁴- eller -CHR⁴C≡CHR⁴-, vari R⁴ är väte eller lägre alkyl; X är O eller S; W är N eller CH; Y är väte, lägre alkyl, lägre alkoxi, hydroxi, halogen eller trifluormetyl; samt deras geometriska och optiska isomerer och farmaceutiskt godtagbara salter. Dessa föreningar är användbara vid behandling av psykosor.