



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN

[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11)(21)	Patenttihakemus-Patentansökan	890559
(51)	Kv.lk. ⁴ /Int.cl. ⁴ A 61 K 39/00, 31/35, C 07 H 15/26	
(22)	Hakemispäivä-Ansökningsdag	06.02.89
(23)	Alkupäivä-Löpdag	
(41)	Tullut julkiseksi-Blivit offentlig	06.02.89
(86)	Kv. hakemus-Int.ansökan	US88/01909
(30)	Etuoikeus-Prioritet	05.06.87 US 058440 27.05.88 US 199549

(71) Hakija/Sökande: *Cytogen Corporation*, 210 College Road East, Forrestal Research Center, Princeton, N.J., USA

(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. King, H. Dalton 2. Lopes, Anthony Dwight 3. Coughlin, Daniel J. 4. Radcliffe, Robert D. 5. Rodwell, John Dennis

(74) Asiamies/Ombud: Berggren

(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Antrasykliiniantibioottien amiinijohdannaiset ja niiden vasta-ainekonjugaatit. Aminderivater av antracyklinantibiotika och antikroppkonjugater av dessa.

(57) Tiivistelmä

Antrasykliiniantibioottien uusia amiinia sisältäviä johdannaisia ja menetelmiä tällaisten johdannaisten valmistamiseksi selostetaan. Johdannaiset ovat käyttökelpoisia valmistettaessa paikkaspesifisesti kiinnittyviä terapeuttisia vasta-aine-antrasykliini-antibioottikonjugaatteja, jotka säilyttävät konjugoimattoman vasta-ainemolekyylin oleellisen immunospesifisyyden. Konjugaatteja käyttämällä saavutetaan antrasykliiniantibioottien kiinnittyvien antineoplastisten amiinijohdannaisten kohdistettu välittäminen. Tällaiset konjugaatit ovat terapeuttisesti tehokkaita useita neoplastisia solusairauksia vastaan, kun niitä annetaan in vivo. Selostetaan myös menetelmiä vasta-ainekonjugaattien valmistamiseksi, ja niiden käyttämiseksi in vivo.

(57) Sammandrag

Det beskrivs nya amininnehållande derivater av antracyklinantibiotika och förfaranden för tillverkning av sådana derivater. Derivater är användbara för tillverkning av platsselektivt bindande terapeutiska antikroppantracyklin-antibiotikumkonjugater, som bevarar den icke-konjugerade antikroppmolekylens väsentliga immunospesifitet. Med användning av konjugater åstadkomms riktad förmedling av bindande antineoplastiska aminderivater av antracyklinantibiotika in vivo. Sådana konjugater är terapeutiskt effektiva mot många neoplastiska cellsjukdomar, när de administreras in vivo. Det beskrivs också förfaranden för framställning av sådana antikroppkonjugater och för användning av konjugater in vivo.