



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 20002260

(51) Kv.lk.7 - Int.kl.7

C07J 41/00, A61K 31/565

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 13.10.2000

(24) Alkuperä - Löpdag 28.08.1992

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 13.10.2000

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/GB92/01587

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

29.08.1991 GB 9118478 P

SUOMI - FINLAND (FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN

(71) Hakija - Sökande

1 •Sterix Limited, Magdalen Centre, Rover Robinson avenue, The Oxford Science Park, Oxford, ISO-BRITANNIA, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1 •Reed, Michael John, 42 Wimborne Gardens, London, W12 8BZ, ISO-BRITANNIA, (GB)

2 •Potter, Barry Victor Lloyd, 95 Dovers Park, Bathford, Bath Avon BA1 7UE, ISO-BRITANNIA, (GB)

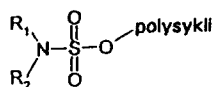
(74) Asiamies - Ombud: Oy Jalo Ant-Wuorinen Ab
Iso Roobertinkatu 4 - 6 A, 00120 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Menetelmä steroidisulfataasi-inhibiittoreita sisältävien farmaseuttisten koostumusten valmistamiseksi
Förfarande för framställning av farmaceutiska kompositioner, som innehåller steroidisulfatasinhibitorer

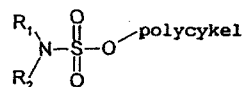
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee menetelmiä uusia steroidi-sulfataasi-inhibiittoreita sisältävien farmaseuttisten koostumusten valmistamiseksi käytettäväksi estronista riippuvien kasvaimien, erityisesti rintasyövän, hoidossa. Uusia steroidisulfataasi-inhibiittoreita ovat sulfamaattiesterit, joilla on kaava I



jossa R_1 ja R_2 ovat kumpikin H, alkyyli, alkenyyli, sykloalkyyli tai aryyli tai ne yhdessä tarkoittavat alkeeniryhmää, joka mahdollisesti sisältää heteroatomin, esim. -O:n tai -NH:n, ja -O-polysykli tarkoittaa polysyklisen alkoholin, mieluiten steroidin, kaikkein mieluiten 3-sterolin tähdettä. Edullisia ovat estroni-3-sulfamaatti ja N,N-dimetyylestroni-3-sulfamaatti.

Uppfinningen avser förfaranden för framställning av farmaceutiska kompositioner, som innehåller nya steroidisulfatasinhibitorer och som skall användas för behandling av tumörer, som är beroende av estron, särskilt för behandling av bröst-cancer. De nya steroidisulfatasinhibitorerna är sulfamater med formeln I



vari R_1 och R_2 är båda H, alkyl, alkenyl, cykloalkyl eller aryl eller de tillsammans betecknar en alkengrupp, som eventuellt innehåller en heteroatom, t.ex. -O- eller -NH-, och O-polycykel betecknar en rest av en polycyklisk alkohol, helst sterol, allra helst 3-sterol. Estron-3-sulfamat och N,N-dimylestron-3-sulfamat är fördelaktiga.