



## SUOMI-FINLAND

(FI)

**Patentti- ja rekisterihallitus**  
**Patent- och registerstyrelsen**

(71) Hakija - Sökande

1. Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue, New York, N.Y. 10154, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Kadow, John F., 9 Quarry Run Court, Wallingford, Conn. 06492, USA, (US)

2. Wittman, Mark D., 328 South Brooksvale Road, Cheshire, Conn. 06410, USA, (US)

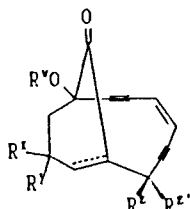
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

**Sytotoksisia bisyklo(7.3.1)tridek-4-eeni-2,6-diyniyhdisteitä ja menetelmä niiden valmistamiseksi**  
**Cytotoxiska bicyklo(7.3.1)tridek-4-en-2,6-diynföreningar och förfarande för framställning av dessa**

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee uutta menetelmää kaavan (VIIa) mukaisten bisyklo[7.3.1]tridek-4-eeni-2,6-diyniyhdisteiden valmistamiseksi,



VIIa

jossa ---- on kaksoissidos, yksinkertainen sidos tai epoksi; toinen R<sup>x</sup>:stä tai R<sup>y</sup>:stä on vety ja toinen on vety tai hydroksi; tai R<sup>x</sup> ja R<sup>y</sup> yhdessä muodostavat oksoryhmän; R<sup>w</sup> on vety, -C(O)R<sup>s</sup>, -C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup> tai -C(O)OR<sup>v</sup>; R<sup>t</sup> ja R<sup>t'</sup> ovat kumpikin vetyjä, tai toinen niistä on vety ja toinen on hydroksi, -OC(O)R<sup>s</sup>, -OC(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup> tai -OC(O)OR<sup>v</sup>; R<sup>s</sup> on vety, alkyyli, sykloalkyyli, aryyli, aralkyyli tai kinoksalyyli; R<sup>t</sup> ja R<sup>u</sup> ovat vety, alkyyli, aminosubstituoitu alkyyli, sykloalkyyli, aryyli, aralkyyli, pyridyyli tai kinoksalyyli; ja R<sup>v</sup> on alkyyli, halogeenisubstituoitu alkyyli, sykloalkyyli, aryyli tai aralkyyli; edellyttäen, että kun R<sup>w</sup>, R<sup>x</sup>, R<sup>y</sup> ja R<sup>t'</sup> ovat kaikki vetyjä ja ---- on kaksoissidos, R<sup>t</sup> ei ole hydroksi. Yhdisteet (VIIa) ovat sytotoksisia syövänvastaisia aineita. Keksintö koskee myös valmistusta (VIIa).

Uppfinningen avser ett nytt förfarande för framställning av bicyklo[7.3.1]tridec-4-en-2,6-diynföreningar med formeln (VIIa), vari ---- är en dubbelbindning, en enkel bindning eller epoxi; en av R<sup>x</sup> eller R<sup>y</sup> är väte och den andra är väte eller hydroxi; eller R<sup>x</sup> och R<sup>y</sup> bildar tillsammans en oxo-grupp; R<sup>w</sup> är väte, -C(O)R<sup>s</sup>, -C(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup> eller -C(O)OR<sup>v</sup>; R<sup>z'</sup> är vardera väte, eller en av dem är väte och den andra är hydroxi, -OC(O)R<sup>s</sup>, -OC(O)NR<sup>t</sup>R<sup>u</sup> eller -OC(O)OR<sup>v</sup>; R<sup>s</sup> är väte, alkyl, cykloalkyl, aryl, aralkyl eller kinoxalyli; R<sup>t</sup> och R<sup>u</sup> är väte, alkyl, aminosubstituerad alkyl, cykloalkyl, aryl, aralkyl, pyridyl eller kinoxalyli; och R<sup>v</sup> är alkyl, halogensubstituerad alkyl, cykloalkyl, aryl eller aralkyl; under förutsättning, att när R<sup>w</sup>, R<sup>x</sup>, R<sup>y</sup> och R<sup>z'</sup> samtliga är väte och ---- är en dubbelbindning, är R<sup>z</sup> icke hydroxi. Föreningarna (VIIa) är cytotoxiska antitumörmedel. Uppfinningen avser även föreningarna (VIIa).