



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 894124
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5
C 07H 17/04
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 01.09.89
(24) Alkuperä - Löpdag 01.09.89
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 07.03.90
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

06.09.88 US 240971

(71) Hakija - Sökande

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

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Ohnuma, Takeshi, 1313, Zushi-machi, Machida-shi, Tokyo, Japan, (JP)
2. Yamasaki, Tetsuro, 5-1-401, Tsunashimadai, Kohoku-ku, Yokohama, Japan, (JP)
3. Kamei, Hideo, 3-30-6, Takaidohigashi, Suginami-ku, Tokyo, Japan, (JP)
4. Naito, Takayuki, 2657-45, Ohzenji, Asao-ku, Kawasaki, Japan, (JP)

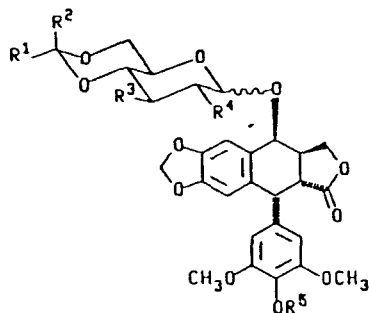
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Fluorisubstituoituja epipodofyllotoksiiniglukosideja
Fluorsubstituerade epipodofyllotoxinglukosider

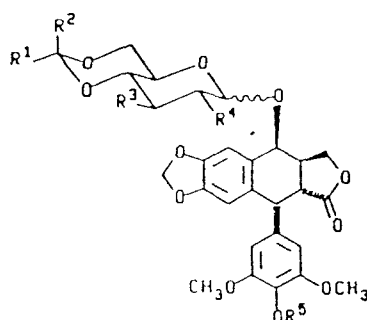
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee kasvainten vastaisten fluorisubstituoitujen 4'-demetyyliepi-podofyllotoksiiniglukosidien valmistusta. Yhdisteillä on kaava



jossa R^2 on H ja R^1 on alkyyl, alkenyyli, sykloalkyyli, 2-furyyli, 2-tienyyli, aryyli, aralkyyli tai aralkenyyli, joissa aromaattinen rengas voi olla substituoitu; tai R^1 ja R^2 merkitsevät kumpikin alkyylä; tai R^1 ja R^2 yhdessä hiiliatomin kanssa, johon ne ovat sitoutuneet, muodostavat sykloalkyyli-ryhmän; toinen R^3 :sta tai R^4 :sta on OH ja toinen on F; R^5 on H tai fenolisuojarahma; ja $\sim$ on α - tai β -glykosididisidos.

Uppfinningen avser framställning av antitumöra fluorsubstituerade 4'-demetyliepipo-dofyllotoxinglukosider. Föreningarna har formeln



där R^2 är H och R^1 är alkyl, alkenyl, cykloalkyl, 2-furyl, 2-tienyl, aryl, aralkyl eller aralkenyl, i vilka den aromatiska ringen kan vara substituerad; eller R^1 och R^2 vardera betecknar alkyl; eller R^1 och R^2 tillsammans med kolatomen, vid vilken de är bundna, bildar en cykloalkylgrupp; den ena av R^3 och R^4 är OH och den andra är F; R^5 är H eller en fenolskyddsgrupp; och $\sim$ är en α - eller β -glykosidbindning.