



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	960465
(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6	
C 07J 1/00	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	01.02.96
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	01.08.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	01.02.96
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/EP94/02540
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
02.08.93 DE 4326240 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Schering Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, Germany, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Bull, James Ronald, 107 Sandown Road, Rondebosch, Cape Town, South Africa, (ZA)
2. Fritzemeier, Karl-Heinrich, Rohrweihstrasse 32, 13505 Berlin, Germany, (DE)
3. Hegele-Hartung, Christa, Am Waldpark 18, 13467 Berlin, Germany, (DE)

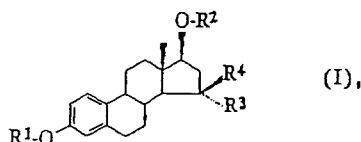
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

15,15-dialkyylisubstituoituja estradiolin johdannaisia
15,15-dialkyylisubstituerade estradiolderivat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Kuvataan uusia 15,15-dialkyylisubstituoituja estradiolin johdannaisia, joilla on yleinen kaava I



jossa R¹ ja R², toisistaan riippumatta, ovat kumpikin vetyatomi, haarautumattoman ketjun alkanoyyliryhmä, jossa on 1 - 10 hiiliatomia, haarautuneen ketjun alkanoyyliryhmä, jossa on 3 - 10 hiiliatomia, alkanoyyliryhmä, jossa on 3 - 10 hiiliatomia ja joka sisältää 3 - 6 rengashiiliatomin sykloalifaattisen rakenteen, tai bentsoyyliryhmä, ja R³ ja R⁴, toisistaan riippumatta, ovat kumpikin haarautumattoman ketjun alkyyliryhmä, jossa on 1 - 10 hiiliatomia, tai haarautuneen ketjun alkyyliryhmä, jossa on 3 - 10 hiiliatomia, menetelmä niiden valmistamiseksi ja tämän menetelmän alkutuotteet. Uusilla yhdisteillä on myös oraalisen antamisen jälkeen suuri estrogeninen tehokkuus ja ne ovat sopivia farmaseuttisten aineiden valmistusta varten.

Beskrives nya 15,15-dialkyylisubstituerade estradiolderivat med den allmänna formeln I, vari R¹ och R² oberoende av varandra betecknar en väteatom, en rakkedjad alkanoylgrupp med 1 - 10 kolatomer, en förgrenad alkanoylgrupp med 3 - 10 kolatomer, en alkanoylgrupp med 3 - 10 kolatomer innehållande en cykloalifatisk struktur med 3 - 6 ringkolatomer eller en bensoylgrupp, och R³ och R⁴ betecknar oberoende av varandra en rakkedjad alkylgrupp med 1 - 10 kolatomer eller en förgrenad alkylgrupp med 3 - 10 kolatomer, ett förfarande för framställning av dessa och utgångsprodukterna för detta förfarande. De nya föreningarna besitter även efter oral dosering en hög estrogen effektivitet och de är lämpliga för framställning av farmaceutiska ämnen.